

PATENT ABSTRACTS OF JAPAN

(11)Publication number : 2002-308857

(43)Date of publication of application : 23.10.2002

(51)Int.Cl.

C07D261/10
A01N 43/80
A01N 43/828
A01N 43/836
A01N 43/90
A01N 47/16
A01N 47/38
C07D261/08
C07D413/12
C07D417/12

(21)Application number : 2001-215942

(71)Applicant : KUMIAI CHEM IND CO LTD
IHARA CHEM IND CO LTD

(22)Date of filing : 16.07.2001

(72)Inventor : NAKATANI MASAHISA
KUGO RYOTARO
MIYAZAKI MASAHIRO
SUMI KOICHIRO
FUJINAMI SHU
UENO RYOHEI
TAKAHASHI SATOSHI

(30)Priority

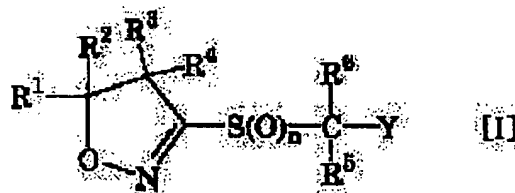
Priority number : 2001031784 Priority date : 08.02.2001 Priority country : JP

(54) ISOXAZOLINE DERIVATIVE AND WEED-KILLER CONTAINING THE SAME AS ACTIVE COMPONENT

(57)Abstract:

PROBLEM TO BE SOLVED: To provide an isoxazoline derivative which is excellent in weeding effect and in capability for selecting crops from weeds.

SOLUTION: This isoxazoline derivative is represented by formula [I] (wherein R¹ and R² are each an alkyl; R³, R⁴, R⁵, and R⁶ are each H; Y is an optionally substituted, 5- or 6-membered, aromatic heterocyclic or aromatic fused heterocyclic group having a heteroatom selected from among N, O, and S; and n is 0, 1 or 2).



LEGAL STATUS

[Date of request for examination]

[Date of sending the examiner's decision of rejection]

[Kind of final disposal of application other than the
examiner's decision of rejection or application converted
registration]

[Date of final disposal for application]

[Patent number]

[Date of registration]

[Number of appeal against examiner's decision of
rejection]

[Date of requesting appeal against examiner's decision
of rejection]

[Date of extinction of right]

Copyright (C); 1998,2003 Japan Patent Office

(19) 日本国特許庁 (J P)

(12) 公開特許公報 (A)

(11) 特許出願公開番号

特開2002-308857

(P2002-308857A)

(43) 公開日 平成14年10月23日 (2002. 10. 23)

| (51) Int. Cl. ⁷ | 識別記号 | F I | 特許庁 ⁷ (参考) |
|---------------------------------------|-------|----------------|-----------------------|
| C 0 7 D 261/10 | | C 0 7 D 261/10 | 4 C 0 5 6 |
| A 0 1 N 43/80 | 1 0 1 | A 0 1 N 43/80 | 1 0 1 4 C 0 6 3 |
| 43/828 | | 43/90 | 1 0 3 4 H 0 1 1 |
| 43/836 | | 47/16 | Z |
| 43/90 | 1 0 3 | 47/38 | B |
| 審査請求 未請求 請求項の数19 O L (全 188 頁) 最終頁に続く | | | |

(21) 出願番号 特願2001-215942 (P2001-215942)

(22) 出願日 平成13年7月16日 (2001. 7. 16)

(31) 優先権主張番号 特願2001-31784 (P2001-31784)

(32) 優先日 平成13年2月8日 (2001. 2. 8)

(33) 優先権主張国 日本 (J P)

(71) 出願人 000000169

クミアイ化学工業株式会社
東京都台東区池之端1丁目4番26号

(71) 出願人 000102049

イハラケミカル工業株式会社
東京都台東区池之端1丁目4番26号

(72) 発明者 中谷 昌央

静岡県磐田郡福田町道新田408番地の1
株式会社ケイ・アイ研究所内

(72) 発明者 久保 良太郎

大阪府泉南市岡田5丁目27番地の23

最終頁に続く

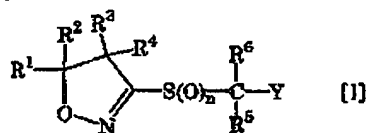
(54) 【発明の名称】 イソオキサゾリン誘導体及びこれを有効成分とする除草剤

(57) 【要約】

【課題】 本発明は、優れた除草効果と作物・雑草間の選択性を有するイソオキサゾリン誘導体を提供することを課題とする。

【解決手段】 本発明のイソオキサゾリン誘導体は、一般式

【化1】



【式中、R²及びR³は、同一又は異なって、アルキル基を示し、R¹、R⁴、R⁵は、水素原子を示し、Yは窒素原子、酸素原子及び硫黄原子より選択される任意のヘテロ原子を有する5～6員の置換されていてもよい芳香族ヘテロ環基又は芳香族ヘテロ縮合環基を示し、nは0～2の整数を示す。】で表される。

(2)

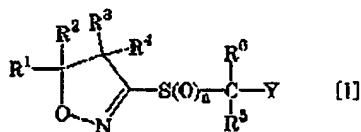
特開2002-308857

1

【特許請求の範囲】

【請求項1】一般式【I】を有するイソオキサゾリン誘導体又はその薬理上許容される塩：

【化1】



式中、

R¹及びR¹'は、同一又は異なって、水素原子、C1～C10アルキル基、C3～C8シクロアルキル基又はC3～C8シクロアルキルC1～C3アルキル基を示すか、或いはR¹とR¹'とが一緒になって、これらの結合した炭素原子と共にC3～C7のスピロ環を示し、

R²及びR²'は、同一又は異なって、水素原子、C1～C10アルキル基又はC3～C8シクロアルキル基を示すか、或いはR²'とR²'とが一緒になって、これらの結合した炭素原子と共にC3～C7のスピロ環を示し、さらにR²、

R²、R²及びR²'はこれらの結合した炭素原子と共に5～8員環を形成することもでき、

R³及びR³'は、同一又は相異なって、水素原子又はC1～C10アルキル基を示し、

Yは窒素原子、酸素原子及び硫黄原子より選択される任意のヘテロ原子を有する5～6員の芳香族ヘテロ環基又は芳香族ヘテロ縮合環基を示し、これらのヘテロ環基は置換基群αより選択される。0～6個の同一又は相異なる基で置換されていてもよく、又、隣接したアルキル基同士、アルコキシ基同士、アルキル基とアルコキシ基、アルキル基とアルキルチオ基、アルキル基とアルキルスルホニル基、アルキル基とモノアルキルアミノ基又はアルキル基とジアルキルアミノ基が2個結合して1～4個のハロゲン原子で置換されてもよい5～8員環を形成されていてもよく、又、これらのヘテロ環基のヘテロ原子が窒素原子の時は酸化されてN-オキシドになってもよく、

nは0～2の整数を示す。

「置換基群α」水酸基、チオール基、ハロゲン原子、C1～C10アルキル基、置換基群βより選択される任意の基でモノ置換されたC1～C10アルキル基、C1～C4ハロアルキル基、C3～C8シクロアルキル基、C1～C10アルコキシ基、置換基群γより選択される任意の基でモノ置換されたC1～C10アルコキシ基、C1～C4ハロアルコキシ基、C3～C8シクロアルキルオキシ基、C3～C8シクロアルキルC1～C3アルキルオキシ基、C1～C10アルキルチオ基、置換基群γより選択される任意の基でモノ置換されたC1～C10アルキルチオ基、C1～C4ハロアルキルチオ基、C2～C6アルケニル基、C2～C6アルケニルオキシ基、C2～C6アルキニル基、C2～C6アルキニルオキシ基、C1～C10アルキルスルフィニル

2

基、置換基群γより選択される任意の基でモノ置換されたC1～C10アルキルスルフィニル基、C1～C10アルキルスルホニル基、置換基群γより選択される任意の基でモノ置換されたC1～C10アルキルスルホニル基、C1～C4ハロアルキルスルフィニル基、置換基群γより選択される任意の基でモノ置換されたC1～C10アルキルスルホニルオキシ基、C1～C4ハロアルキルスルホニルオキシ基、C1～C4ハロアルキルスルホニルオキシ基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいフェノキシ基、置換されていてもよいフェニルチオ基、置換されていてもよい芳香族ヘテロ環基、置換されていてもよい芳香族ヘテロ環オキシ基、置換されていてもよい芳香族ヘテロ環チオ基、置換されていてもよいフェニルスルフィニル基、置換されていてもよいフェニルスルホニル基、置換されていてもよい芳香族ヘテロ環スルホニル基、置換されていてもよいフェニルスルホニルオキシ基、アシル基、C1～C4ハロアルキルカルボニル基、置換されていてもよいベンジルカルボニル基、置換されていてもよいベンゾイル基、カルボキシ基、C1～C10アルコキシカルボニル基、置換されていてもよいベンジルオキシカルボニル基、置換されていてもよいフェノキシカルボニル基、シアノ基、カルバモイル基（該基の窒素原子は同一又は異なって、C1～C10アルキル基又は置換されていてもよいフェニル基で置換されていてもよい）、C1～C6アシルオキシ基、C1～C4ハロアルキルカルボニルオキシ基、置換されていてもよいベンジルカルボニルオキシ基、置換されていてもよいベンゾイルオキシ基、ニトロ基、アミノ基（該基の窒素原子は同一又は異なって、C1～C10アルキル基、置換されていてもよいフェニル基、C1～C6アシル基、C1～C4ハロアルキルカルボニル基、置換されていてもよいベンジルカルボニル基、置換されていてもよいベンゾイル基、C1～C10アルキルスルホニル基、C1～C4ハロアルキルスルホニル基、置換されていてもよいベンジルスルホニル基又は置換されていてもよいフェニルスルホニル基で置換されていてもよい。）

「置換基群β」水酸基、C3～C8シクロアルキル基（該基はハロゲン原子又はアルキル基で置換されてもよい）、C1～C10アルコキシ基、C1～C10アルキルチオ基、C1～C10アルキルスルホニル基、C1～C10アルコキシカルボニル基、C2～C6ハロアルケニル基、アミノ基（該基の窒素原子は同一又は異なって、C1～C10アルキル基、C1～C6アシル基、C1～C4ハロアルキルカルボニル基、C1～C10アルキルスルホニル基、C1～C4ハロアルキルスルホニル基で置換されていてもよい）、カルバモイル基（該基の窒素原子は同一又は異なって、C1～C10アルキル基で置換されていてもよい）、C1～C6アシル基、C1～C4ハロアルキルカルボニル基、C1～C10アルコキシイミノ基、シアノ基、置

(3)

特開2002-308857

3

換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいフェノキシ基

「置換基群 γ 」C1~C10アルコキシカルボニル基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよい芳香族ヘテロ環基、シアノ基、カルバモイル基（該基の窒素原子は同一又は異なって、C1~C10アルキル基で置換されていてもよい。）

【請求項2】0~6個の同一又は相異なる基で置換されていてもよいヘテロ環上の置換基群 α が水酸基、ハロゲン原子、C1~C10アルキル基、置換基群 β より選択される任意の基でモノ置換されたC1~C10アルキル基、C1~C4ハロアルキル基、C3~C8シクロアルキル基、C1~C10アルコキシ基、置換基群 γ より選択される任意の基でモノ置換されたC1~C10アルコキシ基、C1~C4ハロアルコキシ基、C3~C8シクロアルキルオキシ基、C3~C8シクロアルキルC1~C3アルキルオキシ基、C1~C10アルキルチオ基、置換基群 γ より選択される任意の基でモノ置換されたC1~C10アルキルチオ基、C1~C4ハロアルキルチオ基、C2~C6アルケニル基、C2~C6アルケニルオキシ基、C2~C6アルキニル基、C2~C6アルキニルオキシ基、C1~C10アルキルスルホニル基、C1~C4ハロアルキルスルホニル基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいフェノキシ基、置換されていてもよいフェニルチオ基、置換されていてもよい芳香族ヘテロ環基、置換されていてもよい芳香族ヘテロ環オキシ基、置換されていてもよい芳香族ヘテロ環チオ基、置換されていてもよいフェニルスルホニル基、置換されていてもよい芳香族ヘテロ環スルホニル基、C1~C6アシル基、C1~C4ハロアルキルカルボニル基、置換されていてもよいベンジルカルボニル基、置換されていてもよいベンゾイル基、カルボキシ基、C1~C10アルコキシカルボニル基、シアノ基、カルバモイル基（該基の窒素原子は同一又は異なって、C1~C10アルキル基又は置換されていてもよいフェニル基で置換されていてもよい。）ニトロ基、アミノ基（該基の窒素原子は同一又は異なって、C1~C10アルキル基、置換されていてもよいフェニル基、C1~C6アシル基、C1~C4ハロアルキルカルボニル基、置換されていてもよいベンジルカルボニル基、置換されていてもよいベンゾイル基、C1~C10アルキルスルホニル基、C1~C4ハロアルキルスルホニル基、置換されていてもよいベンジルスルホニル基又は置換されていてもよいフェニルスルホニル基で置換されていてもよい。）であるか、或いは隣接したアルキル基同士、アルコキシ基同士、アルキル基とアルコキシ基、アルキル基とアルキルチオ基、アルキル基とアルキルスルホニル基、アルキル基とモノアルキルアミノ基又はアルキル基とジアルキルアミノ基が2個結合して1~4個のハロゲン原子で置換されてもよい5~8員環を形成されていてもよい請求項1記載のイソオキサゾリン誘導体。

4

【請求項3】0~6個の同一又は相異なる基で置換されていてもよいヘテロ環上の置換基群 α がハロゲン原子、C1~C10アルキル基、C1~C4ハロアルキル基、C1~C10アルコキシC1~C3アルキル基、C3~C8シクロアルキル基（該基はハロゲン原子又はアルキル基で置換されてもよい）、C1~C10アルコキシ基、C1~C4ハロアルコキシ基、C3~C8シクロアルキルC1~C3アルキルオキシ基、置換されていてもよいフェノキシ基、C1~C10アルキルチオ基、C1~C10アルキルスルホニル基、アシル基、C1~C4ハロアルキルカルボニル基、C1~C10アルコキシカルボニル基、シアノ基又はカルバモイル基（該基の窒素原子は同一又は異なってC1~C10アルキル基で置換されていてもよい）である請求項2記載のイソオキサゾリン誘導体。

【請求項4】R¹及びR⁴が、同一又は異なってメチル基もしくはエチル基、R¹、R⁴、R⁵及びR⁶が水素原子である請求項1、2又は3記載のイソオキサゾリン誘導体。

【請求項5】Yが窒素原子、酸素原子及び硫黄原子より選択される任意のヘテロ原子を有する5員環又は6員環の芳香族ヘテロ環基である請求項1、2、3又は4記載のイソオキサゾリン誘導体。

【請求項6】Yがチエニル基、ピラゾリル基、イソキサゾリル基、イソチアゾリル基、ピリジル基又はピリミジニル基である請求項5記載のイソオキサゾリン誘導体。

【請求項7】Yがチオフェン-3-イル基、ピラゾール-4-イル基、ピラゾール-5-イル基、イソキサゾール-4-イル基、イソチアゾール-4-イル基、ピリジン-3-イル基又はピリミジン-5-イル基である請求項6記載のイソオキサゾリン誘導体。

【請求項8】Yがチオフェン-3-イル基で、置換基群 α がチオフェン環の2及び4位に必ず置換した請求項7記載のイソオキサゾリン誘導体。

【請求項9】Yがピラゾール-4-イル基で、置換基群 α がピラゾール環の3及び5位に、さらに1位に水素原子、C1~C10アルキル基、置換基群 β より選択される任意の基でモノ置換されたC1~C10アルキル基、C1~C4ハロアルキル基、C3~C8シクロアルキル基、C2~C6アルケニル基、C2~C6アルキニル基、C1~C10アルキルスルフィニル基、C1~C10アルキルスルホニル基、置換基群 γ より選択される任意の基でモノ置換されたC1~C10アルキルスルホニル基、C1~C4ハロアルキルスルホニル基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよい芳香族ヘテロ環基、置換されていてもよいフェニルスルホニル基、置換されていてもよい芳香族ヘテロ環スルホニル基、アシル基、C1~C4ハロアルキルカルボニル基、置換されていてもよいベンジルカルボニル基、置換されていてもよいベンゾイル基、C1~C10アルコキシカルボニル基、置換されていてもよいベンジロキシカルボニル基、置換されていてもよい

(5)

特開2002-308857

7

水素原子、C1~C10アルキル基、C3~C8シクロアルキル基又はC3~C8シクロアルキルC1~C3アルキル基を示すか、或いはR'とR'とが一緒になって、これらの結合した炭素原子と共にC3~C7のスピロ環を示し、R'及びR'は、同一又は異なって、水素原子、C1~C10アルキル基又はC3~C8シクロアルキル基を示すか、或いはR'とR'とが一緒になって、これらの結合した炭素原子と共にC3~C7のスピロ環を示し、さらにR¹、R²、R³及びR⁴はこれらの結合した炭素原子と共に5~8員環を形成することでも、R³及びR⁴は、同一又は相異なって、水素原子又はC1~C10アルキル基を示し、Yは窒素原子、酸素原子及び硫黄原子より選択される任意のヘテロ原子を有する5~6員の芳香族ヘテロ環基又は芳香族ヘテロ縮合環基を示し、これらのヘテロ環基は置換基群αより選択される、0~6個の同一又は相異なる基で置換されていてもよく、又、隣接したアルキル基同士、アルコキシ基同士、アルキル基とアルコキシ基、アルキル基とアルキルチオ基、アルキル基とアルキルスルホニル基、アルキル基とモノアルキルアミノ基又はアルキル基とジアルキルアミノ基が2個結合して1~4個のハロゲン原子で置換されてもよい5~8員環を形成されていてもよく、又、これらのヘテロ環基のヘテロ原子が窒素原子の場合は酸化されてN-オキシドになってもよく、nは0~2の整数を示す。

「置換基群α」水酸基、チオール基、ハロゲン原子、C1~C10アルキル基、置換基群βより選択される任意の基でモノ置換されたC1~C10アルキル基、C1~C4ハロアルキル基、C3~C8シクロアルキル基、C1~C10アルコキシ基、置換基群γより選択される任意の基でモノ置換されたC1~C10アルコキシ基、C1~C4ハロアルコキシ基、C3~C8シクロアルキルオキシ基、C3~C8シクロアルキルC1~C3アルキルオキシ基、C1~C10アルキルチオ基、置換基群γより選択される任意の基でモノ置換されたC1~C10アルキルチオ基、C1~C4ハロアルキルチオ基、C2~C6アルケニル基、C2~C6アルケニルオキシ基、C2~C6アルキニル基、C2~C6アルキニルオキシ基、C1~C10アルキルスルフィニル基、置換基群γより選択される任意の基でモノ置換されたC1~C10アルキルスルフィニル基、C1~C10アルキルスルホニル基、置換基群γより選択される任意の基でモノ置換されたC1~C10アルキルスルホニル基、C1~C4ハロアルキルスルホニル基、置換基群γより選択される任意の基でモノ置換されたC1~C10アルキルスルホニルオキシ基、C1~C4ハロアルキルスルホニルオキシ基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいフェニルチオ基、置換されていてもよい芳香族ヘテロ環基、置換されていてもよい芳香族ヘテロ環オキシ基、置換されていてもよい芳香族ヘテロ環

8

チオ基、置換されていてもよいフェニルスルフィニル基、置換されていてもよいフェニルスルホニル基、置換されていてもよい芳香族ヘテロ環スルホニル基、置換されていてもよいフェニルスルホニルオキシ基、アシル基、C1~C4ハロアルキルカルボニル基、置換されていてもよいベンジルカルボニル基、置換されていてもよいベンゾイル基、カルボキシ基、C1~C10アルコキシカルボニル基、置換されていてもよいベンジルオキシカルボニル基、置換されていてもよいフェノキシカルボニル基、シアノ基、カルバモイル基（該基の窒素原子は同一又は異なって、C1~C10アルキル基又は置換されていてもよいフェニル基で置換されていてもよい）、C1~C6アシルオキシ基、C1~C4ハロアルキルカルボニルオキシ基、置換されていてもよいベンジルカルボニルオキシ基、置換されていてもよいベンゾイルオキシ基、ニトロ基、アミノ基（該基の窒素原子は同一又は異なって、C1~C10アルキル基、置換されていてもよいフェニル基、C1~C6アシル基、C1~C4ハロアルキルカルボニル基、置換されていてもよいベンジルカルボニル基、置換されていてもよいベンゾイル基、C1~C10アルキルスルホニル基、C1~C4ハロアルキルスルホニル基、置換されていてもよいベンジルスルホニル基又は置換されていてもよいフェニルスルホニル基で置換されていてもよい。）

「置換基群β」水酸基、C3~C8シクロアルキル基（該基はハロゲン原子又はアルキル基で置換されてもよい）、C1~C10アルコキシ基、C1~C10アルキルチオ基、C1~C10アルキルスルホニル基、C1~C10アルコキシカルボニル基、C2~C6ハロアルケニル基、アミノ基（該基の窒素原子は同一又は異なって、C1~C10アルキル基、C1~C6アシル基、C1~C4ハロアルキルカルボニル基、C1~C10アルキルスルホニル基、C1~C4ハロアルキルスルホニル基で置換されていてもよい）、カルバモイル基（該基の窒素原子は同一又は異なって、C1~C10アルキル基で置換されていてもよい）、C1~C6アシル基、C1~C4ハロアルキルカルボニル基、C1~C10アルコキシイミノ基、シアノ基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいフェノキシ基

「置換基群γ」C1~C10アルコキシカルボニル基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよい芳香族ヘテロ環基、シアノ基、カルバモイル基（該基の窒素原子は同一又は異なって、C1~C10アルキル基で置換されていてもよい。）

(2) 0~6個の同一又は相異なる基で置換されていてもよいヘテロ環上の置換基群αが水酸基、ハロゲン原子、C1~C10アルキル基、置換基群βより選択される任意の基でモノ置換されたC1~C10アルキル基、C1~C4ハロアルキル基、C3~C8シクロアルキル基、C1~C10アルコキシ基、置換基群γより選択される任意の基

(6)

特開2002-308857

9

10

でモノ置換されたC1~C10アルコキシ基、C1~C4ハロアルコキシ基、C3~C8シクロアルキルオキシ基、C3~C8シクロアルキルC1~C3アルキルオキシ基、C1~C10アルキルチオ基、置換基群 γ より選択される任意の基でモノ置換されたC1~C10アルキルチオ基、C1~C4ハロアルキルチオ基、C2~C6アルケニル基、C2~C6アルケニルオキシ基、C2~C6アルキニル基、C2~C6アルキニルオキシ基、C1~C10アルキルスルホニル基、C1~C4ハロアルキルスルホニル基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいフェノキシ基、置換されていてもよいフェニルチオ基、置換されていてもよい芳香族ヘテロ環基、置換されていてもよい芳香族ヘテロ環オキシ基、置換されていてもよい芳香族ヘテロ環チオ基、置換されていてもよいフェニルスルホニル基、置換されていてもよい芳香族ヘテロ環スルホニル基、C1~C6アシル基、C1~C4ハロアルキルカルボニル基、置換されていてもよいベンジルカルボニル基、置換されていてもよいベンゾイル基、カルボキシル基、C1~C10アルコキシカルボニル基、シアノ基、カルバモイル基（該基の窒素原子は同一又は異なって、C1~C10アルキル基又は置換されていてもよいフェニル基で置換されていてもよい）、ニトロ基、アミノ基（該基の窒素原子は同一又は異なって、C1~C10アルキル基、置換されていてもよいフェニル基、C1~C6アシル基、C1~C4ハロアルキルカルボニル基、置換されていてもよいベンジルカルボニル基、置換されていてもよいベンゾイル基、C1~C10アルキルスルホニル基、C1~C4ハロアルキルスルホニル基、置換されていてもよいベンジルスルホニル基又は置換されていてもよいフェニルスルホニル基で置換されていてもよい）であるか或いは隣接したアルキル基同士、アルコキシ基同士、アルキル基とアルコキシ基、アルキル基とアルキルチオ基、アルキル基とアルキルスルホニル基、アルキル基とモノアルキルアミノ基又はアルキル基とジアルキルアミノ基が2個結合して1~4個のハロゲン原子で置換されてもよい5~8員環を形成されていてもよい（1）に記載のイソキサゾリン誘導体。

（3）0~6個の同一又は相異なる基で置換されていてもよいヘテロ環上の置換基群 α がハロゲン原子、C1~C10アルキル基、C1~C4ハロアルキル基、C1~C10アルコキシC1~C3アルキル基、C3~C8シクロアルキル基（該基はハロゲン原子又はアルキル基で置換されてもよい）、C1~C10アルコキシ基、C1~C4ハロアルコキシ基、C3~C8シクロアルキルC1~C3アルキルオキシ基、置換されていてもよいフェノキシ基、C1~C10アルキルチオ基、C1~C10アルキルスルホニル基、アシル基、C1~C4ハロアルキルカルボニル基、C1~C10アルコキシカルボニル基、シアノ基又はカルバモイル基（該基の窒素原子は同一又は異なってC1~C10アルキル基で置換されていてもよい）である（2）に記載の

イソキサゾリン誘導体。

（4）R¹及びR²が、同一又は異なってメチル基もしくはエチル基、R¹、R²、R³及びR⁴が窒素原子である（1）、（2）又は（3）に記載のイソキサゾリン誘導体。

（5）Yが窒素原子、酸素原子及び硫黄原子より選択される任意のヘテロ原子を有する5員環又は6員環の芳香族ヘテロ環基である（1）、（2）、（3）又は（4）に記載のイソキサゾリン誘導体。

（6）Yがチエニル基、ピラゾリル基、イソキサゾリル基、イソチアゾリル基、ビリジル基又はピリミジニル基である（5）に記載のイソキサゾリン誘導体。

（7）Yがチオフェン-3-イル基、ピラゾール-4-イル基、ピラゾール-5-イル基、イソキサゾール-4-イル基、イソチアゾール-4-イル基、ビリジン-3-イル基又はピリミジン-5-イル基である（6）に記載のイソキサゾリン誘導体。

（8）Yがチオフェン-3-イル基で、置換基群 α がチオフェン環の2及び4位に必ず置換した（7）に記載のイソキサゾリン誘導体。

（9）Yがピラゾール-4-イル基で、置換基群 α がピラゾール環の3及び5位に、さらに1位に窒素原子、C1~C10アルキル基、置換基群 β より選択される任意の基でモノ置換されたC1~C10アルキル基、C1~C4ハロアルキル基、C3~C8シクロアルキル基、C2~C6アルケニル基、C2~C6アルキニル基、C1~C10アルキルスルフィニル基、C1~C10アルキルスルホニル基、置換基群 γ より選択される任意の基でモノ置換されたC1~C10アルキルスルホニル基、C1~C4ハロアルキルスルホニル基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよい芳香族ヘテロ環基、置換されていてもよいフェニルスルホニル基、置換されていてもよい芳香族ヘテロ環スルホニル基、アシル基、C1~C4ハロアルキルカルボニル基、置換されていてもよいベンジルカルボニル基、置換されていてもよいベンゾイル基、C1~C10アルコキシカルボニル基、置換されていてもよいベンジルオキシカルボニル基、置換されていてもよいフェノキシカルボニル基、カルバモイル基（該基の窒素原子は同一又は異なって、C1~C10アルキル基又は置換されていてもよいフェニル基で置換されていてもよい）、アミノ基（該基の窒素原子は同一又は異なって、C1~C10アルキル基、置換されていてもよいフェニル基、アシル基、C1~C4ハロアルキルカルボニル基、置換されていてもよいベンジルカルボニル基、置換されていてもよいベンゾイル基、C1~C10アルキルスルホニル基、C1~C4ハロアルキルスルホニル基、置換されていてもよいベンジルスルホニル基又は置換されていてもよいフェニルスルホニル基で置換されていてもよい）が必ず置換した（7）に記載のイソキサゾリン誘導体。

（10）Yがピラゾール-5-イル基で、置換基群 α が

11

ピラゾール環の4位に、さらに1位に水素原子、C1~C10アルキル基、置換基群 β より選択される任意の基でモノ置換されたC1~C10アルキル基、C1~C4ハロアルキル基、C3~C8シクロアルキル基、C2~C6アルケニル基、C2~C6アルキニル基、C1~C10アルキルスルフィニル基、C1~C10アルキルスルホニル基、置換基群 γ より選択される任意の基でモノ置換されたC1~C10アルキルスルホニル基、C1~C4ハロアルキルスルホニル基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよい芳香族ヘテロ環基、置換されていてもよいフェニルスルホニル基、置換されていてもよい芳香族ヘテロ環スルホニル基、アシル基、C1~C4ハロアルキルカルボニル基、置換されていてもよいベンジルカルボニル基、置換されていてもよいベンゾイル基、C1~C10アルコキシカルボニル基、置換されていてもよいベンジロキシカルボニル基、置換されていてもよいフェノキシカルボニル基、カルバモイル基（該基の窒素原子は同一又は異なって、C1~C10アルキル基又は置換されていてもよいフェニル基で置換されていてもよい）、アミノ基（該基の窒素原子は同一又は異なって、C1~C10アルキル基、置換されていてもよいフェニル基、アシル基、C1~C4ハロアルキルカルボニル基、置換されていてもよいベンジルカルボニル基、置換されていてもよいベンゾイル基、C1~C10アルキルスルホニル基、C1~C4ハロアルキルスルホニル基、置換されていてもよいベンジルスルホニル基又は置換されていてもよいフェニルスルホニル基で置換されていてもよい）が必ず置換した（7）に記載のイソオキサゾリン誘導体。

（11）Yがイソオキサゾール-4-イル基で、置換基群 α がイソオキサゾール環の3位及び5位に必ず置換した（7）に記載のイソオキサゾリン誘導体。

（12）Yがイソチアゾール-4-イル基で、置換基群 α がイソチアゾール環の3位及び5位に必ず置換した（7）に記載のイソオキサゾリン誘導体。

（13）Yがピリジン-3-イル基で、置換基群 α がピリジン環の2位及び4位に必ず置換した（7）に記載のイソオキサゾリン誘導体。

（14）Yがピリミジン-5-イル基で、置換基群 α がピリミジン環の4位及び6位に必ず置換した（7）に記載のイソオキサゾリン誘導体。

（15）nが2の整数である（1）~（14）のいずれかに記載のイソオキサゾリン誘導体。

（16）nが1の整数である（1）~（14）のいずれかに記載のイソオキサゾリン誘導体。

（17）nが0の整数である（1）~（14）のいずれかに記載のイソオキサゾリン誘導体。

（18）（1）~（17）のいずれかに記載のイソオキサゾリン誘導体又は薬理上許容される塩を有効成分として含有する除草剤。

（19）（16）及び（17）に記載のイソオキサゾリ

(7)

特開2002-308857

12

ン誘導体又は、（15）に記載のイソオキサゾリン誘導体の製造中間体。

【0008】尚、本明細書において、用いられる用語の定義を以下に示す。

【0009】C1~C10等の表記は、この場合ではこれに続く置換基の炭素数が、1~10であることを示している。

【0010】ハロゲン原子とは、フッ素原子、塩素原子、臭素原子又はヨウ素原子を示す。

【0011】C1~C10アルキル基とは、特に限定しない限り、炭素数が1~10の直鎖又は分岐鎖状のアルキル基を示し、例えばメチル基、エチル基、n-プロピル基、イソプロピル基、n-ブチル基、イソブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基、n-ペンチル基、イソペンチル基、ネオペンチル基、n-ヘキシル基、イソヘキシル基、3,3-ジメチルブチル基、ヘプチル基、又はオクチル基等を挙げることができる。

【0012】C3~C8シクロアルキル基とは、炭素数が3~8のシクロアルキル基を示し、例えばシクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、又はシクロヘキシル基等を挙げることができる。

【0013】C3~C8シクロアルキルC1~C3アルキル基（該基はハロゲン原子又はアルキル基で置換されてもよい）とは、特に限定しない限り同一又は異なって、ハロゲン原子1~4又はC1~C3アルキル基で置換されてもよいC3~C8シクロアルキル基により置換されたC1~C3アルキル基を示し、例えばシクロプロピルメチル基、1-シクロプロピルエチル基、2-シクロプロピルエチル基、1-シクロプロピルプロピル基、2-シクロプロピルプロピル基、3-シクロプロピルプロピル基、シクロブチルメチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基2-クロロシクロプロピルメチル基、2,2-ジクロロシクロプロピルメチル基、2-フルオロシクロプロピルメチル基、2,2-ジフルオロシクロプロピルメチル基、2-メチルシクロプロピルメチル基、2,2-ジメチルシクロプロピルメチル基、又は2-メチルシクロプロピルエチル基等を挙げるができる。

【0014】C3~C8シクロアルキルC1~C3アルキル基とは、炭素数が3~8のシクロアルキル基により置換された炭素数1~3のアルキル基を示し、例えばシクロプロピルメチル基、1-シクロプロピルエチル基、2-シクロプロピルエチル基、1-シクロプロピルプロピル基、2-シクロプロピルプロピル基、3-シクロプロピルプロピル基、シクロブチルメチル基、シクロペンチルメチル基、又はシクロヘキシルメチル基等を挙げるができる。

【0015】C1~C4ハロアルキル基とは、特に限定しない限り、同一又は異なって、ハロゲン原子1~9で置換されている炭素数が1~4の直鎖又は分岐鎖のアルキ

50

(8)

特開2002-308857

13

ル基を示し、例えばフルオロメチル基、クロロメチル基、ブロモメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、2,2-ジフルオロエチル基、2,2,2-トリフルオロエチル基、又はペンタフルオロエチル基等を挙げることができる。

【0016】C2~C6アルケニル基とは、炭素数が2~6の直鎖又は分岐鎖のアルケニル基を示し、例えばエチニル基、1-プロペニル基、2-プロペニル基、イソプロペニル基、1-ブテニル基、2-ブテニル基、3-ブテニル基、又は2-ペンテニル基等を挙げることができる。

【0017】C2~C6アルキニル基とは、炭素数が2~6の直鎖又は分岐鎖のアルキニル基を示し、例えばエチニル基、2-プロピニル基、1-メチル-2-プロピニル基、2-ブチニル基、3-ブチニル基、又は2-メチル-3-ブチニル基等を挙げることができる。

【0018】C2~C6ハロアルケニル基とは、特に限定しない限り、同一又は異なって、ハロゲン原子1~4で置換されている炭素数が2~6の直鎖又は分岐鎖のアルケニル基を示し、例えば3-クロロ-2-プロペニル基、又は2-クロロ-2-プロペニル基等を挙げることができる。

【0019】C1~C10アルコキシ基とは、アルキル部分が上記の意味である(アルキル)-O-基を示し、例えばメトキシ基、エトキシ基、n-プロポキシ基、イソプロポキシ基、tert-ブトキシ基、n-ブトキシ基、sec-ブトキシ基、又はイソブトキシ基等を挙げることができる。

【0020】C1~C4ハロアルコキシ基とは、ハロアルキル部分が上記の意味である(ハロアルキル)-O-基を示し、例えばジフルオロメトキシ基、トリフルオロメトキシ基、2,2-ジフルオロエトキシ基、又は2,2,2-トリフルオロエトキシ基等を挙げることができる。

【0021】C3~C8シクロアルキルオキシ基とは、シクロアルキル部分が上記の意味である(シクロアルキル)-O-基を示し、例えばシクロプロピルオキシ基、シクロブチルオキシ基、シクロペンチルオキシ基、又はシクロヘキシルオキシ基等を挙げることができる。

【0022】C3~C8シクロアルキルC1~C3アルキルオキシ基とは、シクロアルキルアルキル部分が上記の意味である(シクロアルキルアルキル)-O-基を示し、例えばシクロプロピルメトキシ基、1-シクロプロピルエトキシ基、2-シクロプロピルエトキシ基、1-シクロプロピルプロポキシ基、2-シクロプロピルプロポキシ基、3-シクロプロピルプロポキシ基、シクロブチルメトキシ基、シクロペンチルメトキシ基、又はシクロヘキシルメトキシ基等を挙げることができる。

【0023】C2~C6アルケニルオキシ基及びC2~C6アルキニルオキシ基とは、アルケニル又はアルキニル部分が上記の意味である(アルケニル)-O-基、(アル

14

キニル)-O-基を示し、例えば2-プロペニルオキシ基、又は2-プロピニルオキシ基等を挙げることができる。

【0024】C1~C10アルコキシイミノ基とは、アルコキシ部分が上記の意味である(アルコキシ)-N=基を示し、例えばメトキシイミノ基又はエトキシイミノ基等を挙げることができる。

【0025】C1~C10アルキルチオ基、C1~C10アルキルスルフィニル基及びC1~C10アルキルスルホニル基とは、アルキル部分が上記の意味である(アルキル)-S-基、(アルキル)-SO-基、(アルキル)-SO₂-基を示し、例えばメチルチオ基、エチルチオ基、n-プロピルチオ基、イソプロピルチオ基、メチルスルフィニル基、メチルスルホニル基、エチルスルホニル基、n-プロピルスルホニル基、又はイソプロピルスルホニル基等を挙げることができる。

【0026】C1~C10アルキルスルホニルオキシ基とは、アルキルスルホニル部分が上記の意味である(アルキルスルホニル)-O-基を示し、例えばメチルスルホニルオキシ基又はエチルスルホニルオキシ基等を挙げることができる。

【0027】C1~C10アルコキシカルボニル基とは、アルコキシ部分が上記の意味である(アルコキシ)-CO-基を示し、例えばメトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、n-プロポキシカルボニル基、又はイソプロポキシカルボニル基等を挙げることができる。

【0028】C1~C6アシル基とは、炭素数1~6の直鎖又は分岐鎖状の脂肪族アシル基を示し、例えばホルミル基、アセチル基、プロピオニル基、イソプロピオニル基、ブチリル基、又はピバロイル基等を挙げることができる。

【0029】C1~C10アシルオキシ基とは、アシル部分が上記の意味である(アシル)-O-基、を示し、例えばアセトキシ基、プロピオニルオキシ基、イソプロピオニルオキシ基、又はピバロイルオキシ基等を挙げることができる。

【0030】C1~C4ハロアルキルカルボニル基、C1~C4ハロアルキルチオ基及びC1~C4ハロアルキルスルホニル基とは、ハロアルキル部分が上記の意味である(ハロアルキル)-CO-基、(ハロアルキル)-S-基、(ハロアルキル)-SO₂-基を示し、例えばクロロアセチル基、トリフルオロアセチル基、ペンタフルオロプロピオニル基、ジフルオロメチルチオ基、トリフルオロメチルチオ基、クロロメチルスルホニル基、ジフルオロメチルスルホニル基、又はトリフルオロメチルスルホニル基等を挙げることができる。

【0031】C1~C4ハロアルキルカルボニルオキシ基及びC1~C4ハロアルキルスルホニルオキシ基とは、ハロアルキルカルボニル部分及びハロアルキルスルホニル部分が上記の意味である(ハロアルキルカルボニル)-

15

O-基、(ハロアルキルスルホニル)-O-基を示し、例えばクロロアセチルオキシ基、トリフルオロアセチルオキシ基、クロロメチルスルホニルオキシ基、又はトリフルオロメチルスルホニルオキシ基等を挙げることができる。

【0032】(置換されていてもよい)フェニル基、(置換されていてもよい)芳香族ヘテロ環基、(置換されていてもよい)フェノキシ基、(置換されていてもよい)芳香族ヘテロ環オキシ基、(置換されていてもよい)フェニルチオ基、(置換されていてもよい)芳香族ヘテロ環チオ基、(置換されていてもよい)フェニルスルホニル基、(置換されていてもよい)フェニルスルホニルオキシ基、(置換されていてもよい)芳香族ヘテロ環スルホニル基、(置換されていてもよい)ベンジルカルボニル基、(置換されていてもよい)ベンジルカルボニルオキシ基、(置換されていてもよい)ベンジルスルホニル基、(置換されていてもよい)ベンゾイル基、(置換されていてもよい)ベンゾイルオキシ基、(置換されていてもよい)ベンジルオキシカルボニル基又は(置換されていてもよい)フェノキシカルボニル基における「置換されていてもよい基」とは、例えばハロゲン原子、C1~C10アルキル基、C1~C4ハロアルキル基、C1~C10アルコキシアルキル基、C1~C10アルコキシ基、C1~C10アルキルチオ基、C1~C10アルキルスルホニル基、アシル基、C1~C10アルコキシカルボニル基、シアノ基、カルバモイル基(該基の窒素原子は同一又は異なって、C1~C10アルキル基で置換されていてもよい)、ニトロ基、又はアミノ基(該基の窒素原子は同一又は異なって、C1~C10アルキル基、C1~C6アシル基、C1~C4ハロアルキルカルボニル基、C1~C10アルキルスルホニル基、又はC1~C4ハロアルキルスルホニル基で置換されていてもよい)等で置換されていてもよいことを示す。

【0033】窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から任意に選択されるヘテロ原子を有する5員から6員の芳香族ヘテロ環基とは、例えばヘテロ原子を1から3個有するフリル基、チエニル基、ピロリル基、ピラゾリル基、イソキサゾリル基、イソチアゾリル基、オキサゾリル基、チアゾリル基、イミダゾリル基、ピリジル基、ピリダジニル基、ピリミジニル基、ピラジニル基、トリアジニル基、トリアゾリル基、オキサジアゾリル基又はチアジアゾリル基を挙げることができる。

【0034】芳香族ヘテロ環台環基とは、窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から任意に選択されるヘテロ原子を1~3個有する基を示し、例えばベンゾフリル基、ベンゾチエニル基、インドリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾイソキサゾリル基、ベンゾイソチアゾリル基、インダゾリル基、キノリル基、イソキノリル基、フサラジニル基、キノキサリニル基、キナゾリニル基、シンノリニル基又

(9)

特開2002-308857

16

はベンゾトリアゾリル基を挙げることができる。

【0035】(置換されていてもよい)芳香族ヘテロ環基、(置換されていてもよい)芳香族ヘテロ環オキシ基、(置換されていてもよい)芳香族ヘテロ環チオ基又は(置換されていてもよい)芳香族ヘテロ環スルホニル基の芳香族ヘテロ環とは、窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から任意に選択されるヘテロ原子を1~3個有する5~6員の基を示し、例えばフリル基、チエニル基、ピロリル基、ピラゾリル基、イソキサゾリル基、イソチアゾリル基、オキサゾリル基、チアゾリル基、イミダゾリル基、ピリジル基、ピリダジニル基、ピリミジニル基、ピラジニル基、トリアジニル基、トリアゾリル基、オキサジアゾリル基又はチアジアゾリル基を挙げることができる。

【0036】薬理上許容される塩とは、一般式【I】を有する化合物において、水酸基、カルボキシ基又はアミノ基等がその構造中に存在する場合に、これらと金属もしくは有機塩基との塩又は酸塩基もしくは有機酸との塩であり、金属としてはナトリウム又はカリウム等のアルカリ金属或いはマグネシウム又はカルシウム等のアルカリ土類金属を挙げることができ、有機塩基としてはトリエチルアミン又はジイソプロピルアミン等を挙げることができ、酸としては塩酸又は硫酸等を挙げることができ、有機酸としては酢酸、メタンスルホン酸又はp-トルエンスルホン酸等を挙げることができる。

【0037】上記した一般式【I】の中で好ましくは、R¹及びR²が、同一又は異なってメチル基又はエチル基であり、R³、R⁴、R⁵及びR⁶が水素原子であり、nが2の整数であり、Yがチオフェン-3-イル基(ここで該基の2位及び4位は、ハロゲン原子、アルキル基、ハロアルキル基、アルコキシアルキル基、シクロアルキル基、アルコキシ基、ハロアルコキシ基、アシル基、ハロアルキルカルボニル基、アルコキシカルボニル基、シアノ基又はカルバモイル基(該基の窒素原子は同一又は異なってアルキル基で置換されていてもよい)が必ず置換する。)、ピラゾール-4-イル基(ここで該基の3位及び5位は、ハロゲン原子、アルキル基、ハロアルキル基、アルコキシアルキル基、シクロアルキル基、アルコキシ基、ハロアルコキシ基、シクロアルキルアルキルオキシ基、置換されていてもよいフェノキシ基、アルキルチオ基、アルキルスルホニル基、アシル基、ハロアルキルカルボニル基、アルコキシカルボニル基、シアノ基又はカルバモイル基(該基の窒素原子は同一又は異なってアルキル基で置換されていてもよい)が、さらに1位に水素原子、アルキル基、置換基群より選択される任意の基でモノ置換されたアルキル基、ハロアルキル基、シクロアルキル基、アルケニル基、アルキニル基、アルキルスルホニル基、置換基群より選択される任意の基でモノ置換されたアルキルスルホニル基、ハロアルキルスルホニル基、置換されていてもよいフェニル基、置換

(10)

特開2002-308857

17

されていてもよい芳香族ヘテロ環基、置換されていてもよいフェニルスルホニル基、置換されていてもよい芳香族ヘテロスルホニル基、アシル基、ハロアルキルカルボニル基、置換されていてもよいベンジルカルボニル基、置換されていてもよいベンゾイル基、アルコキシカルボニル基、置換されていてもよいベンジロキシカルボニル基、置換されていてもよいフェノキシカルボニル基又はカルバモイル基（該基の窒素原子は同一又は異なっており、アルキル基又は置換されていてもよいフェニル基で置換されていてもよい）が必ず置換する。）、ピラゾール-5-イル基（ここで該基の4位はハロゲン原子、アルキル基、ハロアルキル基、アルコキシアルキル基、ハロアルコキシ基、アシル基、ハロアルキルカルボニル基、アルコキシカルボニル基、シアノ基又はカルバモイル基（該基の窒素原子は同一又は異なっておりアルキル基で置換されていてもよい）が、さらに1位は水素原子、アルキル基、置換基群より選択される任意の基で置換されたアルキル基、ハロアルキル基、シクロアルキル基又は置換されていてもよいフェニル基が必ず置換する。）、イソキサゾール-4-イル基（該基の3位及び5位は、ハロゲン原子、アルキル基、ハロアルキル基、アルコキシアルキル基、シクロアルキル基、アルコキシ基、ハロアルコキシ基、アルキルチオ基、アルキルスルホニル基、アシル基、ハロアルキルカルボニル基、アルコキシカルボニル基、シアノ基又はカルバモイル基（該基の窒素原子は同一又は異なっておりアルキル基で置換されていてもよい）が必ず置換する。）、イソチアゾール-4-イル基（該基の3位及び5位は、ハロゲン原子、アルキル基、ハロアルキル基、アルコキシアルキル基、シクロアルキル基、アルコキシ基、ハロアルコキシ基、アルキルチオ基、アルキルスルホニル基、アシル基、ハロアルキルカルボニル基、アルコキシカルボニル基、シアノ基又はカルバモイル基（該基の窒素原子は同一又は異なっておりアルキル基で置換されていてもよい）が必ず置換する。）、イソキサゾリン誘導体。

18

* 基、置換されていてもよいフェノキシ基、アルキルチオ基、アルキルスルホニル基、アシル基、ハロアルキルカルボニル基、アルコキシカルボニル基、シアノ基、カルバモイル基（該基の窒素原子は同一又は異なっておりアルキル基で置換されていてもよい）が必ず置換する。）、ピリジン-3-イル基（該基の2位及び4位は、ハロゲン原子、アルキル基、ハロアルキル基、アルコキシアルキル基、シクロアルキル基、アルコキシ基、ハロアルコキシ基、アルキルチオ基、アルキルスルホニル基、アシル基、ハロアルキルカルボニル基、アルコキシカルボニル基、シアノ基又はカルバモイル基（該基の窒素原子は同一又は異なっておりアルキル基で置換されていてもよい）が必ず置換する。）、或いはピリミジン-5-イル基（該基の4位および6位は、ハロゲン原子、アルキル基、ハロアルキル基、アルコキシアルキル基、シクロアルキル基、アルコキシ基、ハロアルコキシ基、アルキルチオ基、アルキルスルホニル基、アシル基、ハロアルキルカルボニル基、アルコキシカルボニル基、シアノ基又はカルバモイル基（該基の窒素原子は同一又は異なっておりアルキル基で置換されていてもよい）が必ず置換する。）、であるイソキサゾリン誘導体。

【0038】

【発明の実施の形態】次に、一般式〔I〕を有する本発明化合物の代表的な化合物例を表1～表130に記載する。しかしながら、本発明化合物はこれらに限定されるものではない。尚、化合物番号は以後の記載において参照される。

【0039】本明細書における表中の次の表記は下記の通りそれぞれ該当する基を表す。

【0040】

| | | | |
|------|-------------|-------|------------|
| Me | : メチル基 | Et | : エチル基 |
| Pr | : n-プロピル基 | Pr-i | : イソプロピル基 |
| Pr-c | : シクロプロピル基 | Bu | : n-ブチル基 |
| Bu-i | : iso-ブチル基 | Bu-s | : sec-ブチル基 |
| Bu-t | : tert-ブチル基 | Bu-c | : シクロブチル基 |
| Pen | : n-ペンチル基 | Pen-c | : シクロペンチル基 |
| Hex | : n-ヘキシル基 | Hex-c | : シクロヘキシル基 |
| Ph | : フェニル基 | | |

また、例えば(4-Cl)Phの表記は4-クロロフェニル基、3-Hexは3-ヘキシル基を表す。

【0041】尚、本発明化合物は置換基として水酸基を含む場合、ケト-エノール互変異性体を有する化合物が

あるが、何れの異性体もその混合物も本発明化合物に含まれる。

【0042】

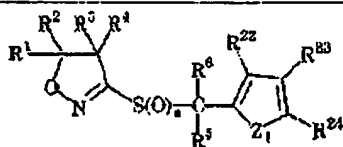
【表1】

(11)

特開2002-308857

19

20



| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | Z ¹ | R ²² | R ²³ | R ²⁴ |
|----------------|------------------------------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|----------------|---------------------|-----------------|--------------------------|
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | Me | H | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | Cl | Me | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | H | H | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | Cl | H | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | H | H | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | OMe | H | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | OEt | H | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | OCHF ₂ | H | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | OCH ₂ Ph | H | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | H | H | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | H | H | C(=O)OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NMe | Me | H | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NMe | Me | C(=O)OMe | CH ₂ C(=O)OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NMe | Me | C(=O)OEt | CH ₂ C(=O)OEt |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NMe | Me | Me | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NPh | OMe | H | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NPh | OEt | H | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NPh | OCHF ₂ | H | H |
| H | H | H | H | 2 | H | H | S | OCHF ₂ | H | H |
| Me | H | H | H | 2 | H | H | S | OCHF ₂ | H | H |
| Me | H | Me | H | 2 | H | H | S | OCHF ₂ | H | H |
| Me | Me | H | H | 2 | Me | H | S | OCHF ₂ | H | H |
| Me | Me | H | H | 2 | Et | H | S | OCHF ₂ | H | H |
| Me | Me | H | H | 2 | Pr-i | H | S | OCHF ₂ | H | H |
| Me | Me | H | H | 2 | Me | Me | S | OCHF ₂ | H | H |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | S | OCHF ₂ | H | H |
| Et | Et | H | H | 2 | H | H | S | OCHF ₂ | H | H |
| Me | Pr-i | H | H | 2 | H | H | S | OCHF ₂ | H | H |
| Me | Pr | H | H | 2 | H | H | S | OCHF ₂ | H | H |
| Me | Pr-c | H | H | 2 | H | H | S | OCHF ₂ | H | H |
| Me | CH ₂ Pr-c | H | H | 2 | H | H | S | OCHF ₂ | H | H |
| | -(CH ₂) ₂ - | H | H | 2 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| | -(CH ₂) ₃ - | H | H | 2 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| | -(CH ₂) ₄ - | H | H | 2 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| | -(CH ₂) ₅ - | H | H | 2 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| H | -(CH ₂) ₃ - | H | H | 2 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| H | -(CH ₂) ₄ - | H | H | 2 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| H | -(CH ₂) ₅ - | H | H | 2 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| H | -(CH ₂) ₆ - | H | H | 2 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |

【0043】

【表2】

21

22

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | Z ¹ | R ²² | R ²³ | R ²⁴ |
|----------------|----------------------------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|----------------|---------------------|-----------------|--------------------------|
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | Me | H | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | Cl | Me | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | H | H | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | Cl | H | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | H | H | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | OMe | H | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | OEt | H | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | OCHF ₂ | H | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | OCH ₂ Ph | H | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | H | H | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | H | H | C(=O)OMe |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NMe | Me | H | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NMe | Me | C(=O)OMe | CH ₂ C(=O)OMe |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NMe | Me | C(=O)OEt | CH ₂ C(=O)OEt |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NMe | Me | Me | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NPh | OMe | H | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NPh | OEt | H | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NPh | OCHF ₂ | H | H |
| H | H | H | H | 1 | H | H | S | OCHF ₂ | H | H |
| Me | H | H | H | 1 | H | H | S | OCHF ₂ | H | H |
| Me | H | Me | H | 1 | H | H | S | OCHF ₂ | H | H |
| Me | Me | H | H | 1 | Me | H | S | OCHF ₂ | H | H |
| Me | Me | H | H | 1 | Et | H | S | OCHF ₂ | H | H |
| Me | Me | H | H | 1 | Pr-i | H | S | OCHF ₂ | H | H |
| Me | Me | H | H | 1 | Me | Me | S | OCHF ₂ | H | H |
| Me | Et | H | H | 1 | H | H | S | OCHF ₂ | H | H |
| Et | Et | H | H | 1 | H | H | S | OCHF ₂ | H | H |
| Me | Pr-i | H | H | 1 | H | H | S | OCHF ₂ | H | H |
| Me | Pr | H | H | 1 | H | H | S | OCHF ₂ | H | H |
| Me | Pr-c | H | H | 1 | H | H | S | OCHF ₂ | H | H |
| Me | CH ₂ Pr-c | H | H | 1 | H | H | S | OCHF ₂ | H | H |
| | -(CH ₂) ₂ | H | H | 1 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| | -(CH ₂) ₃ | H | H | 1 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| | -(CH ₂) ₄ | H | H | 1 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| | -(CH ₂) ₅ | H | H | 1 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| H | -(CH ₂) ₃ | H | H | 1 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| H | -(CH ₂) ₄ | H | H | 1 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| H | -(CH ₂) ₅ | H | H | 1 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| H | -(CH ₂) ₆ | H | H | 1 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | Me | H | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | Cl | Me | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | H | H | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | Cl | H | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | H | H | Cl |

【0044】

【表3】

(13)

特開2002-308857

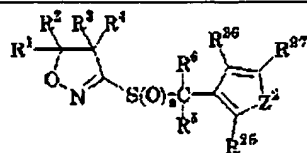
23

24

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | Z ¹ | R ²² | R ²³ | R ²⁴ |
|------------------------------------|------------------------------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|----------------|---------------------|-----------------|--------------------------|
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | OMe | H | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | OEt | H | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | OCHF ₂ | H | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | OCH ₂ Ph | H | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | H | H | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | H | H | C(=O)OMe |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NMe | Me | H | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NMe | Me | C(=O)OMe | CH ₂ C(=O)OMe |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NMe | Me | C(=O)OEt | CH ₂ C(=O)OEt |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NMe | Me | Me | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NPh | OMe | H | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NPh | OEt | H | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NPh | OCHF ₂ | H | H |
| H | H | H | H | 0 | H | H | S | OCHF ₂ | H | H |
| Me | H | H | H | 0 | H | H | S | OCHF ₂ | H | H |
| Me | H | Me | H | 0 | H | H | S | OCHF ₂ | H | H |
| Me | Me | H | H | 0 | Me | H | S | OCHF ₂ | H | H |
| Me | Me | H | H | 0 | Et | H | S | OCHF ₂ | H | H |
| Me | Me | H | H | 0 | Pr-i | H | S | OCHF ₂ | H | H |
| Me | Me | H | H | 0 | Me | Me | S | OCHF ₂ | H | H |
| Me | Et | H | H | 0 | H | H | S | OCHF ₂ | H | H |
| Et | Et | H | H | 0 | H | H | S | OCHF ₂ | H | H |
| Me | Pr-i | H | H | 0 | H | H | S | OCHF ₂ | H | H |
| Me | Pr | H | H | 0 | H | H | S | OCHF ₂ | H | H |
| Me | Pr-c | H | H | 0 | H | H | S | OCHF ₂ | H | H |
| Me | CH ₂ Pr-c | H | H | 0 | H | H | S | OCHF ₂ | H | H |
| -(CH ₂) ₂ - | | H | H | 0 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| -(CH ₂) ₃ - | | H | H | 0 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| -(CH ₂) ₄ - | | H | H | 0 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| -(CH ₂) ₅ - | | H | H | 0 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| H | -(CH ₂) ₂ - | H | H | 0 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| H | -(CH ₂) ₄ - | H | H | 0 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| H | -(CH ₂) ₅ - | H | H | 0 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| H | -(CH ₂) ₆ - | H | H | 0 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | S | H | H | H |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | O | H | H | H |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | NH | H | H | H |

【0045】

【表4】



| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | Z ¹ | R ²⁵ | R ²⁶ | R ²⁷ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|----------------|----------------------|-------------------------|-----------------|
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | H | H | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | H | OMe | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | Cl | H | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | Cl | Me | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | NHMe | Me | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | N(Me) ₂ | Me | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | NHC(=O)Me | Me | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | NHC(=O)Ph | Me | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | NHSO ₂ Me | Me | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | NHSO ₂ Ph | Me | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | Me | Me | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | Me | C(=O)OMe | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | Me | C(=O)OEt | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | Me | C(=O)OPh | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | Me | CN | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | Me | C(=O)NHMe | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | Me | C(=O)Me | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | Me | C(=O)Et | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | Me | C(=O)Pr-i | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | Me | C(=O)Pr | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | Me | C(=O)CF ₃ | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | Me | C(=NOMe)Me | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | Ph | C(=O)Me | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | Ph | C(=NOMe)Me | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | OMe | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | OEt | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | OPr-i | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | OPr-i | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | OCHF ₂ | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | Cl | Me | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | Cl | Me | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | Cl | C(=O)OMe | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | Cl | CN | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | Cl | C(=O)NHMe | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | Cl | C(=O)N(Me) ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | Cl | C(=O)Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | Cl | C(=O)Et | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | Cl | C(=O)Pr-i | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | Cl | C(=O)Pr | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | Cl | C(=O)CF ₃ | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | Cl | C(=NOMe)Me | Cl |

【0046】

【表5】

(15)

特開2002-308857

27

28

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | Z ¹ | R ²⁵ | R ²⁶ | R ²⁷ |
|---------------------------------|---------------------------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|----------------|----------------------|----------------------|-----------------|
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | H | H | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | Me | H | Cl |
| H | H | H | H | 2 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| Me | H | H | H | 2 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| Me | H | Me | H | 2 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | Me | H | S | Cl | Cl | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | Et | H | S | Cl | Cl | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | Pr-i | H | S | Cl | Cl | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | Me | Me | S | Cl | Cl | Cl |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| Et | Et | H | H | 2 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| Me | Pr-i | H | H | 2 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| Me | Pr | H | H | 2 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| Me | Pr-c | H | H | 2 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| Me | CH ₂ Pr-c | H | H | 2 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| (CH ₂) ₂ | | H | H | 2 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| (CH ₂) ₃ | | H | H | 2 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| (CH ₂) ₄ | | H | H | 2 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| (CH ₂) ₅ | | H | H | 2 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| H | (CH ₂) ₃ | H | 2 | H | H | S | Cl | Cl | Cl | Cl |
| H | (CH ₂) ₄ | H | 2 | H | H | S | Cl | Cl | Cl | Cl |
| H | (CH ₂) ₅ | H | 2 | H | H | S | Cl | Cl | Cl | Cl |
| H | (CH ₂) ₆ | H | 2 | H | H | S | Cl | Cl | Cl | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | H | H | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | H | OMe | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | Cl | H | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | Cl | Me | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | NHMe | Me | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | N(Me) ₂ | Me | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | NHC(=O)Me | Me | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | NHC(=O)Ph | Me | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | NHSO ₂ Me | Me | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | NHSO ₂ Ph | Me | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | Me | Me | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | Me | C(=O)OMe | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | Me | C(=O)OEt | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | Me | C(=O)OPh | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | Me | CN | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | Me | C(=O)NHMe | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | Me | C(=O)Me | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | Me | C(=O)Et | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | Me | C(=O)Pr-i | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | Me | C(=O)Pr | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | Me | C(=O)CF ₃ | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | Me | C(=NOMe)Me | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | Ph | C(=O)Me | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | Ph | C(=NOMe)Me | Me |

【0047】

【表6】

(15)

特開2002-308857

29

30

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | Z ² | R ²⁵ | R ²⁶ | R ²⁷ |
|----------------------------------|----------------------------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|----------------|--------------------|-------------------------|-----------------|
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | CF ₃ | OMe | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | CF ₃ | OBt | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | CF ₃ | OPr-i | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | CF ₃ | OPr-i | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | CF ₃ | OCHF ₂ | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | Cl | Me | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | Cl | Me | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | Cl | C(=O)OMe | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | Cl | CN | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | Cl | C(=O)NHMe | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | Cl | C(=O)N(Me) ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | Cl | C(=O)Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | Cl | C(=O)Et | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | Cl | C(=O)Pr-i | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | Cl | C(=O)Pr | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | Cl | C(=O)CF ₃ | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | Cl | C(=NOMe)Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | H | H | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | Me | H | Cl |
| H | H | H | H | 1 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| Me | H | H | H | 1 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| Me | H | Me | H | 1 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | Me | H | S | Cl | Cl | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | Et | H | S | Cl | Cl | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | Pr-i | H | S | Cl | Cl | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | Me | Me | S | Cl | Cl | Cl |
| Me | Et | H | H | 1 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| Et | Et | H | H | 1 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| Me | Pr-i | H | H | 1 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| Me | Pr | H | H | 1 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| Me | Pr-c | H | H | 1 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| Me | CH ₂ Pr-c | H | H | 1 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| -(CH ₂) ₂ | | H | H | 1 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| -(CH ₂) ₃ | | H | H | 1 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| -(CH ₂) ₄ | | H | H | 1 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| -(CH ₂) ₅ | | H | H | 1 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| H | -(CH ₂) ₅ | H | H | 1 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| H | -(CH ₂) ₄ | H | H | 1 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| H | -(CH ₂) ₃ | H | H | 1 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| H | -(CH ₂) ₂ | H | H | 1 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | H | H | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | H | OMe | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | Cl | H | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | Cl | Me | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | NHMe | Me | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | N(Me) ₂ | Me | H |

[0048]

[表7]

(17)

特開2002-308857

31

32

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | Z ² | R ²⁵ | R ²⁶ | R ²⁷ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|----------------|----------------------|-------------------------|-----------------|
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | NHC(=O)Me | Me | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | NHC(=O)Ph | Me | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | NHSO ₂ Me | Me | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | NHSO ₂ Ph | Me | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | Me | Me | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | Me | C(=O)OMe | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | Me | C(=O)OEt | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | Me | C(=O)OPh | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | Me | CN | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | Me | C(=O)NHMe | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | Me | C(=O)Me | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | Me | C(=O)Et | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | Me | C(=O)Pr-i | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | Me | C(=O)Pr | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | Me | C(=O)CF ₃ | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | Me | C(=NOMe)Me | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | Ph | C(=O)Me | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | Ph | C(=NOMe)Me | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | CF ₃ | OMe | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | CF ₃ | OEt | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | CF ₃ | OPr-i | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | CF ₃ | OPr-i | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | CF ₃ | OCHF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | Cl | Me | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | Cl | Me | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | Cl | C(=O)OMe | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | Cl | CN | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | Cl | C(=O)NHMe | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | Cl | C(=O)N(Me) ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | Cl | C(=O)Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | Cl | C(=O)Et | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | Cl | C(=O)Pr-i | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | Cl | C(=O)Pr | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | Cl | C(=O)CF ₃ | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | Cl | C(=NOMe)Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | H | H | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | Me | H | Cl |
| H | H | H | H | 0 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| Me | H | H | H | 0 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| Me | H | Me | H | 0 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | Me | H | S | Cl | Cl | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | Et | H | S | Cl | Cl | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | Pr-i | H | S | Cl | Cl | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | Me | Me | S | Cl | Cl | Cl |
| Me | Et | H | H | 0 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| Et | Et | H | H | 0 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| Me | Pr-i | H | H | 0 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| Me | Pr | H | H | 0 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| Me | Pr-c | H | H | 0 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |

【0049】

【表8】

(18)

特開2002-308857

33

34

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | Z ¹ | R ²⁵ | R ²⁶ | R ²⁷ |
|----------------|------------------------------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|----------------|-----------------|-----------------|-----------------|
| Me | CH ₂ Pr-c | H | H | 0 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| | -(CH ₂) ₂ - | H | H | 0 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| | -(CH ₂) ₃ - | H | H | 0 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| | -(CH ₂) ₄ - | H | H | 0 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| | -(CH ₂) ₅ - | H | H | 0 | H | H | S | Cl | Cl | Cl |
| H | -(CH ₂) ₂ - | H | 0 | H | H | S | Cl | Cl | Cl | Cl |
| H | -(CH ₂) ₄ - | H | 0 | H | H | S | Cl | Cl | Cl | Cl |
| H | -(CH ₂) ₅ - | H | 0 | H | H | S | Cl | Cl | Cl | Cl |
| H | -(CH ₂) ₆ - | H | 0 | H | H | S | Cl | Cl | Cl | Cl |

【0050】

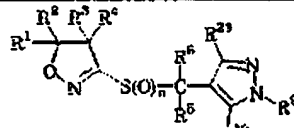
【表9】

(19)

特開2002-308857

35

36

|  | | | | | | | | | |
|---|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|-------------------|----------------|-------------------|
| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | R ⁹ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | H | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OCHF ₂ | H | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OCHF ₂ | H | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | H | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | H | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CHF ₂ | H | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CHF ₂ | H | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | H | F |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | H | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | H | OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | H | OBt |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | H | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | H | CN |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | H | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | Me | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | Me | F |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | F | Me | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | Me | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | Me | OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OMe | Me | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | Me | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OCHF ₂ | Me | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | Me | CN |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CN | Me | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Et | Me | F |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | F | Me | Et |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Et | Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | Me | Et |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Et | Me | OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OMe | Me | Et |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Et | Me | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OCHF ₂ | Me | Et |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Et | Me | CN |

【0051】

【表10】

(20)

特開2002-308857

37

38

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | R ⁹ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|---------------------|----------------|---------------------|
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CN | Me | Et |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Pr-i | Me | F |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | F | Me | Pr-i |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Pr-i | Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | Me | Pr-i |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Pr-i | Me | OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OMe | Me | Pr-i |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Pr-i | Me | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OCHF ₂ | Me | Pr-i |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Pr-i | Me | CN |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CN | Me | Pr-i |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Bu-t | Me | F |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | F | Me | Bu-t |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Bu-t | Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | Me | Bu-t |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Bu-t | Me | OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OMe | Me | Bu-t |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Bu-t | Me | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OCHF ₂ | Me | Bu-t |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Bu-t | Me | CN |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CN | Me | Bu-t |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CH ₂ OMe | Me | F |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | F | Me | CH ₂ OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CH ₂ OMe | Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | Me | CH ₂ OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CH ₂ OMe | Me | OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OMe | Me | CH ₂ OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CH ₂ OMe | Me | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OCHF ₂ | Me | CH ₂ OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CH ₂ OMe | Me | CN |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CN | Me | CH ₂ OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CHF ₂ | Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | Me | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OCHF ₂ | Me | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OCHF ₂ | Me | F |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | F | Me | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OCHF ₂ | Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | Me | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OCHF ₂ | Me | OMe |

【0052】

【表11】

(21)

特開2002-308857

39

40

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | R ⁹ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|-------------------|----------------|-------------------------------------|
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OMe | Me | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OCHF ₂ | Me | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OCHF ₂ | Me | CN |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CN | Me | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | Br |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Br | Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | I |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | I | Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | F |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | F | Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | OH |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OH | Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OMe | Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | OEt |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OEt | Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | OPr-i |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | OPr |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | OBu-t |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | OBu-s |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | OBu-i |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | OBu |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | O(2-Pen) |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | O(3-Pen) |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | OPen-n |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | O(2-Hex) |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | O(3-Hex) |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | OHex-n |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | OPen-c |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | OHex-c |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | OCH ₂ Pr-c |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | OCH ₂ Bu-c |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | OCH ₂ Pen-c |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | OCH ₂ Hex-c |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | OCH ₂ CH=CH ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | OCH ₂ C≡CH |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | OCHF ₂ |

[0053]

[表12]

(22)

特開2002-308857

41

42

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | R ⁹ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|-----------------------------------|----------------|--|
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OCHF ₂ | Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | OCH ₂ CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OCH ₂ CHF ₂ | Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | OCH ₂ CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OCH ₂ CF ₃ | Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | OCH ₂ CN |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | OCH ₂ C(=O)OEt |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | OCH(OMe)C(=O)OEt |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | OCH ₂ C(=O)NH ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | OCH ₂ C(=O)NHMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | OCF ₂ C(=O)N(Me) ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | OCH ₂ Ph |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | OPh |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | O(2-Cl)Ph |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | O(2-Br)Ph |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | O(2-F)Ph |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | O(2-Me)Ph |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | O(2-OMe)Ph |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | O(2-NO ₂)Ph |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | O(2-CN)Ph |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | O(2-C(=O)OMe)Ph |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | O(3-Cl)Ph |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | O(3-Br)Ph |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | O(3-F)Ph |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | O(3-Me)Ph |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | O(3-OMe)Ph |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | O(3-NO ₂)Ph |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | O(3-CN)Ph |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | O(3-C(=O)OMe)Ph |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | O(4-Cl)Ph |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | O(4-Br)Ph |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | O(4-F)Ph |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | O(4-Me)Ph |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | O(4-OMe)Ph |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | O(4-NO ₂)Ph |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | O(4-CN)Ph |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | O(4-C(=O)OMe)Ph |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | OC(=O)Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | OC(=O)Et |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | OC(=O)CH ₂ Ph |

【0054】

【表13】

(23)

特開2002-308857

43

44

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ²⁵ | R ²⁶ | R ²⁷ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|-----------------|-----------------|--|
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | OC(=O)CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | OC(=O)Ph |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | OSO ₂ Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | OSO ₂ Et |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | OSO ₂ CH ₂ Ph |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | OSO ₂ CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | OSO ₂ Ph |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | SM ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | SOMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | SO ₂ Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | SEt |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | SEt |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | SO ₂ Et |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | SPr |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | SOPr |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | SO ₂ Pr |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | SPr-i |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | SOPr-i |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | SO ₂ Pr-i |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | SBu-t |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | SOBu-t |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | SO ₂ Bu-t |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | SCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | SOCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | SO ₂ CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | SCF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | SOOF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | SO ₂ OF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | SPh |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | SOH |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | SO ₂ Ph |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | SOCH ₂ Ph |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | SOCH ₂ Ph |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | SO ₂ CH ₂ Ph |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | SOCH ₂ O(=O)OEt |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | SOCH ₂ C(=O)OEt |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | SO ₂ CH ₂ C(=O)OEt |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | SOCH(Me)C(=O)OEt |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | SOCH(Me)C(=O)OEt |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | SO ₂ CH(Me)C(=O)OEt |

[0055]

[表14]

(24)

特開2002-308857

45

46

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | R ⁹ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|-----------------|----------------|---|
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | SCH ₂ C(=O)NH ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | SOCH ₂ C(=O)NH ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | SO ₂ CH ₂ C(=O)NH ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | SCH ₂ C(=O)NHMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | SOCH ₂ C(=O)NHMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | SO ₂ CH ₂ C(=O)NHMe |
| Me | Me | H | H | 3 | H | H | CF ₃ | Me | SCH ₂ C(=O)N(Me) ₂ |
| Me | Me | H | H | 3 | H | H | CF ₃ | Me | SOCH ₂ C(=O)N(Me) ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | SO ₂ CH ₂ C(=O)N(Me) ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | NH ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | NHMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | N(Me) ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | NHC(=O)Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | N(Me)C(=O)Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | NHSO ₂ Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | N(Me)SO ₂ Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | NHSO ₂ CHF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | N(Me)SO ₂ CHF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | NHSO ₂ CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | N(Me)SO ₂ CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | NHPh |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | N(Me)Ph |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | CN |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CN | Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | C(=O)OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | C(=O)OPr-i |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | C(=O)OCH ₂ Ph |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | C(=O)OPh |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | C(=O)NH ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | C(=O)NHMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | C(=O)N(Me) ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | C(=O)Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | C(=O)CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | C(=O)CH ₂ Ph |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | C(=O)Ph |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | Et |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | Pr-i |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | Pr |

[0056]

【表15】

(25)

特開2002-308857

47

48

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ¹⁰ | R ¹¹ | R ²⁰ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|---------------------------------|-----------------|---------------------|
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OF ₂ | Me | CH ₃ OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | Ph |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₂ CF ₃ | Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CN | Me | F |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | F | Me | CN |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CN | Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | Me | CN |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CN | Me | CN |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | COOMe | Me | F |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | F | Me | COOMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | COOMe | Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | Me | COOMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | SO ₂ Me | Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | Me | SO ₂ Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Ph | Me | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Ph | Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Ph | Me | OEt |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Ph | Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Ph | Me | Ph |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | Et | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OCHF ₂ | Et | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | Et | CN |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CN | Et | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Pr-i | Et | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OCHF ₂ | Et | Pr-i |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Pr-i | Et | CN |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CN | Et | Pr-i |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | Et | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OCHF ₂ | Et | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | Et | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OCHF ₂ | Et | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Et | F |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | F | Et | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Et | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | Et | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Et | OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OMe | Et | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Et | OEt |

[0057]

【表16】

(26)

特開2002-308857

49

50

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | R ⁹ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|-------------------|----------------|-------------------|
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OEt | Et | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Et | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OCHF ₂ | Et | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Et | CN |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CN | Et | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Et | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | Et | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | Pr-i | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OCHF ₂ | Pr-i | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | Pr-i | CN |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CN | Pr-i | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Pr-i | Pr-i | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OCHF ₂ | Pr-i | Pr-i |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Pr-i | Pr-i | CN |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CN | Pr-i | Pr-i |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | Pr-i | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OCHF ₂ | Pr-i | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | Pr-i | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OCHF ₂ | Pr-i | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Pr-i | F |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | F | Pr-i | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Pr-i | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | Pr-i | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Pr-i | OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OMe | Pr-i | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Pr-i | OEt |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OEt | Pr-i | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Pr-i | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OCHF ₂ | Pr-i | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Pr-i | CN |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CN | Pr-i | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Pr-i | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | Pr-i | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | Pr | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OCHF ₂ | Pr | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | Pr | CN |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CN | Pr | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Pr-i | Pr | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OCHF ₂ | Pr | Pr-i |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Pr-i | Pr | CN |

【0058】

【表17】

(27)

特開2002-308857

51

52

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ^{7a} | R ^{7b} | R ⁸ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|-------------------|-----------------|-------------------|
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CN | Pr | Pr-i |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | Pr | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OCHF ₂ | Pr | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | Pr | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OCHF ₂ | Pr | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Pr | F |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | F | Pr | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Pr | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | Pr | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Pr | OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OMe | Pr | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Pr | OEt |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OEt | Pr | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Pr | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OCHF ₂ | Pr | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Pr | CN |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CN | Pr | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Pr | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | Pr | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | Bu-t | F |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | Bu-t | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | Bu-t | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | Bu-t | CN |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | Bu-t | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OCHF ₂ | Bu-t | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OCHF ₂ | Bu-t | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Bu-t | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Bu-t | F |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Bu-t | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | Bu-t | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Bu-t | OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OMe | Bu-t | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Bu-t | OEt |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OEt | Bu-t | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Bu-t | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Bu-t | CN |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Bu-t | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | Bu-t | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Bu-t | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | Bu-t | CF ₃ |

【0059】

【表18】

(28)

特開2002-308857

53

54

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ^{7a} | R ^{7b} | R ^{8a} |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|-------------------|----------------------|-------------------|
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Bu-i | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | Bu-i | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Bu | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | Bu | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | 1-Methylbutyl | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | 1-Methylbutyl | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | 1-Ethylpropyl | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | 1-Ethylpropyl | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | 1-Pentyl | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | 1-Pentyl | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | 1-Methylpentyl | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | 1-Methylpentyl | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | 2-Ethylbutyl | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | 2-Ethylbutyl | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | 3,3-Dimethylbutyl | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | 3,3-Dimethylbutyl | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | 1-Hexyl | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | 1-Hexyl | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | 1-Heptyl | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | 1-Heptyl | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | 1-Octyl | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | 1-Octyl | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH ₂ Ph | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Pr-c | F |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Pr-c | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Pr-c | OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Pr-c | OCHF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Pr-c | CN |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Pen-c | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | Pen-c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Hex-c | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | Hex-c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | CH ₂ Pr-c | OCHF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OCHF ₃ | CH ₂ Pr-c | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH ₂ Pr-c | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OCHF ₃ | CH ₂ Pr-c | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH ₂ Pr-c | OCHF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OCHF ₃ | CH ₂ Pr-c | OCHF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ Pr-c | F |

[0060]

[表19]

(30)

特開2002-308857

57

58

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ^{7a} | R ^{8a} | R ⁹ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|-------------------|--------------------------------------|-------------------|
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ Pr-c | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH ₂ CH ₂ Pr-c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ CH=CH ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH ₂ CH=CH ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ CH=CHCl | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH ₂ CH=CHCl | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | CH ₂ C≡CH | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OCHF ₂ | CH ₂ C≡CH | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH ₂ CCH | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OCHF ₂ | CH ₂ C≡CH | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH ₂ C≡CH | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OCHF ₂ | CH ₂ C≡CH | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ C≡CH | F |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | F | CH ₂ C≡CH | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ C≡CH | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH ₂ C≡CH | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ C≡CH | OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OMe | CH ₂ C≡CH | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ C≡CH | OEt |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OEt | CH ₂ C≡CH | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ C≡CH | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OCHF ₂ | CH ₂ C≡CH | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ C≡CH | CN |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CN | CH ₂ C≡CH | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ C≡CH | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | CH ₂ C≡CH | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CHMeC≡CH | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CHMeC≡CH | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ C≡CMe | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH ₂ C≡CMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | CHF ₂ | F |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | F | CHF ₂ | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | CHF ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CHF ₂ | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | CHF ₂ | OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OMe | CHF ₂ | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | CHF ₂ | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OCHF ₂ | CHF ₂ | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | CHF ₂ | CN |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CN | CHF ₂ | Me |

[0062]

【表21】

(31)

特開2002-308857

59

60

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ²⁰ | R ²¹ | R ²² |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|-------------------|----------------------------------|-------------------|
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | CHF ₂ | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Et | CHF ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CHF ₂ | Et |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Et | CHF ₂ | Et |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Pr-i | CHF ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CHF ₂ | Pr-i |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CHF ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OCHF ₂ | CHF ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CHF ₂ | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OCHF ₂ | CHF ₂ | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CHF ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CHF ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CHF ₂ | F |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | F | CHF ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CHF ₂ | OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OMe | CHF ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CHF ₂ | OEt |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OEt | CHF ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CHF ₂ | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OCHF ₂ | CHF ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CHF ₂ | CN |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CN | CHF ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CHF ₂ | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | CHF ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ CHF ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH ₂ CHF ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ CF ₃ | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH ₂ CF ₃ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ OH | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH ₂ OH | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | CH ₂ OMe | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OCHF ₂ | CH ₂ OMe | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH ₂ OMe | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OCHF ₂ | CH ₂ OMe | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH ₂ OMe | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OCHF ₂ | CH ₂ OMe | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ OMe | F |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | F | CH ₂ OMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ OMe | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH ₂ OMe | CF ₃ |

[0063]

【表22】

(32)

特開2002-308857

61

62

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | α | R ⁵ | R ⁶ | R ²⁰ | R ²¹ | R ²² |
|----------------|----------------|----------------|----------------|----------|----------------|----------------|-------------------|---|-------------------|
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ OMe | OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OMe | CH ₂ OMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ OMe | OEt |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OEt | CH ₂ OMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ OMe | OCHF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OCHF ₂ | CH ₂ OMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ OMe | CN |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CN | CH ₂ OMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ OMe | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | CH ₂ OMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ OEt | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH ₂ OEt | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OH | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH ₂ CH ₂ OH | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OEt | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH ₂ CH ₂ OEt | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ NHMe | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH ₂ NHMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ N(Me) ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH ₂ N(Me) ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ N(Me)C(=O)Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH ₂ N(Me)C(=O)Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ N(Me)C(=O)CF ₃ | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH ₂ N(Me)C(=O)CF ₃ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ N(Me)SO ₂ Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH ₂ N(Me)SO ₂ Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ N(Me)SO ₂ CHF ₃ | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH ₂ N(Me)SO ₂ CHF ₃ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ N(Me)SO ₂ CF ₃ | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH ₂ N(Me)SO ₂ CF ₃ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ SMe | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH ₂ SMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ SO ₂ Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH ₂ SO ₂ Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ SMe | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH ₂ CH ₂ SMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me | CF ₃ |

[0064]

[表23]

(33)

特開2002-308857

63

64

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | R ⁹ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|-----------------|---|-------------------|
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₃ CN | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH ₃ CN | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ C(=O)OMe | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH ₂ C(=O)OMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ C(=O)OEt | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH ₂ C(=O)OEt | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH(Me)C(=O)OMe | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH(Me)C(=O)OMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | C(Me) ₂ C(=O)OMe | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | C(Me) ₂ C(=O)OMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ C(=O)NH ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH ₂ C(=O)NH ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ C(=O)NHMe | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH ₂ C(=O)NHMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ C(=O)N(Me) ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH ₂ C(=O)N(Me) ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ C(=O)Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH ₂ C(=O)Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ C(=NOMe)Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH ₂ C(=NOMe)Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ C(=O)CF ₃ | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH ₂ C(=O)CF ₃ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ C(=O)Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH ₂ CH ₂ C(=O)Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | Ph | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | Ph | F |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | Ph | OCHF ₂ |
| Me | Me | F | H | 2 | H | H | Me | Ph | CN |
| Me | Me | F | H | 2 | H | H | Et | Ph | F |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Et | Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Et | Ph | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Et | Ph | CN |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Pr | Ph | F |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Pr | Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Pr | Ph | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Pr | Ph | CN |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Pr-i | Ph | F |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Pr-i | Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Pr-i | Ph | OCHF ₂ |

[0065]

[表24]

(34)

特開2002-308857

65

66

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ¹⁰ | R ²⁰ | R ³⁰ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|---------------------|-----------------|-------------------------------------|
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Pr-i | Ph | CN |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Bu-t | Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CH ₂ OMe | Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OCHF ₂ | Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OCHF ₂ | Ph | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CHF ₂ | Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | Ph | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | Et |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | Pr-i |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 3 | H | H | CF ₃ | Ph | F |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | Ph | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | OH |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OH | Ph | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OMe | Ph | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | OEt |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OEt | Ph | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | OPr-i |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | OPr |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | OBu-t |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | OCH ₂ Pr-c |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | OCH ₂ CH=CH ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | OCH ₂ C≡CH |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OCHF ₂ | Ph | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | OCH ₂ CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | OCH ₂ CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | OCH ₂ C(=O)OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | OCH(Me)C(=O)OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | OC(Me) ₂ C(=O)OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | OC(=O)Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | OC(=O)Et |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | OC(=O)CH ₂ Ph |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | OC(=O)CF ₃ |

[0066]

【表25】

(35)

特開2002-308857

67

68

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | R ⁹ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|-----------------|----------------|--------------------------------------|
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | OC(=O)Ph |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | OSO ₂ Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | OSO ₂ Et |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | OSO ₂ CH ₂ Ph |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | OSO ₂ CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | OSO ₂ Ph |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | SMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | SOMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | SO ₂ Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | SEt |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | SOEt |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | SO ₂ Et |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | SPr-i |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | SOPr-i |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | SO ₂ Pr-i |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | SPr |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | SOPr |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | SO ₂ Pr |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | SBu-t |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | SOBu-t |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | SO ₂ Bu-t |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | SCHF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | SOCHF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | SO ₂ CHF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | NH ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | NHMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | N(Me) ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | NHC(=O)Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | N(Me)C(=O)Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | NHSO ₂ Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | N(Me)SO ₂ Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | NHSO ₂ CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | N(Me)SO ₂ CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | NHPh |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | N(Me)Ph |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | CN |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | C(=O)Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | C(=O)OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | C(=O)NH ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | C(=O)NHMe |

【0067】

【表26】

(36)

特開2002-308857

69

70

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ^{7a} | R ^{7b} | R ⁸ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|---------------------------------|------------------------------|---------------------------------------|
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | O(=O)N(Me) ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | Imidazol-1-yl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | Pyrazol-1-yl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | 1,2,4-Triazol-1-yl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | 1,2,4-Triazol-4-yl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | Tetrazol-1-yl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | Tetrazol-5-yl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | (4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl)oxy |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | (4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl)sulfonyl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₂ CF ₃ | Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | (2-Cl)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | (2-F)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | (2-OMe)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | (2-Me)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | (2-NO ₂)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | (2-CN)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | (2-C(=O)Me)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | (2-C(=O)OMe)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | (2-C(=O)OEt)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | (2-C(=O)OPr-i)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | (2-C(=O)NH ₂)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | (2-C(=O)NHMe)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | (2-C(=O)NMe ₂)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | (3-Cl)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | (3-F)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | (3-OMe)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | (3-Me)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | (3-NO ₂)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | (3-CN)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | (3-C(=O)Me)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | (3-C(=O)OMe)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | (3-C(=O)OEt)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | (3-C(=O)OPr-i)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | (3-C(=O)NH ₂)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | (3-C(=O)NHMe)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | (3-C(=O)NMe ₂)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | (4-Cl)Ph | Cl |

[0068]

[表27]

(37)

特開2002-308857

71

72

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | E ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | R ⁹ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|-----------------|-------------------------------------|----------------|
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | (4-F)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | (4-OMe)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | (4-Me)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | (4-NO ₂)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | (4-CN)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | (4-C(=O)Me)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | (4-C(=O)OMe)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | (4-C(=O)OEt)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | (4-C(=O)OPr-i)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | (4-C(=O)NH ₂)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | (4-C(=O)NHMe)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | (4-C(=O)NMe ₂)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Pyrimidin-2-yl | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Thiophen-2-yl | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Furan-2-yl | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | SO ₂ Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | SO ₂ Et | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | SO ₂ Pr-i | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | SO ₂ CH ₂ Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | SO ₂ CHF ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | SO ₂ CF ₃ | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | SO ₂ Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | C(=O)Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | C(=O)Et | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | C(=O)Pr-i | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | C(=O)Bu-t | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | C(=O)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | C(=O)CH ₂ Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | C(=O)CH ₂ Cl | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | C(=O)CHCl ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | C(=O)CF ₃ | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | C(=O)OMe | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | C(=O)OPh | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | C(=O)OCH ₂ Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | C(=O)NHMe | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | C(=O)N(Me) ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | C(=O)NHPh | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | NH ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | -(CH ₂) ₄ O- | |

[0069]

[表28]

(38)

特開2002-308857

73

74

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ²⁰ | R ²⁰ |
|----------------|-------------------------------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|-------------------|-----------------|--|
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | | -(CH ₂) ₃ O- |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | | -(CH ₂) ₃ S- |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | | -(CH ₂) ₃ SO ₂ - |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | | -(CH ₂) ₃ O- |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | | -(CH ₂) ₃ O- |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | | -(CH ₂) ₃ S- |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | | -(CH ₂) ₃ SO ₂ - |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OMe | | -(CH ₂) ₃ - |
| Me | Me | H | H | 3 | H | H | OCHF ₂ | | -(CH ₂) ₃ - |
| H | H | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | Cl |
| Me | H | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | Cl |
| Me | H | Me | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | Cl |
| Me | Me | Me | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | Me | H | CF ₃ | Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | Et | H | CF ₃ | Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | Pr-i | H | CF ₃ | Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | Me | Me | CF ₃ | Me | Cl |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | Cl |
| Et | Et | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | Cl |
| Me | Pr-i | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | Cl |
| Me | Pr | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | Cl |
| Me | Pr-c | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | Cl |
| Me | CH ₂ Pr-c | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | Cl |
| | -(CH ₂) ₄ - | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | Cl |
| | -(CH ₂) ₆ - | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | Cl |
| | -(CH ₂) ₈ - | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | Cl |
| | -(CH ₂) ₁₀ - | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | Cl |
| H | -(CH ₂) ₃ - | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | Cl |
| H | -(CH ₂) ₄ - | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | Cl |
| H | -(CH ₂) ₅ - | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | Cl |
| H | -(CH ₂) ₆ - | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | H | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OCHF ₂ | H | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OCHF ₂ | H | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CHF ₂ | H | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | H | F |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | H | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | H | OMe |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | H | OEt |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | H | OCHF ₂ |

[0070]

【表29】

(39)

特開2002-308857

75

76

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | R ⁹ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|-------------------|----------------|-------------------|
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | H | CN |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | H | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Me | Me | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Me | Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | Me | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Et | Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | Me | Et |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Pr-i | Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | Me | Pr-i |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Bu-t | Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | Me | Bu-t |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CHF ₂ | Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | Me | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OCHF ₂ | Me | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OCHF ₂ | Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | Me | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OCHF ₂ | Me | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | F |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | F | Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | OH |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OH | Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | OMe |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OMe | Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | OBt |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OBt | Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | OPr-i |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | OPr |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | OBu-t |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | OBu-s |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | OBu-i |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | OBu |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | O(2-Pen) |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | O(3-Pen) |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | OPen-a |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | O(2-Hex) |

[0071]

[表30]

(40)

特開2002-308857

77

78

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | R ⁹ | R ¹⁰ | R ¹¹ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|-----------------------------------|----------------|----------------|-----------------|--|
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | | | O(2-Hex) |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | | | OHex-n |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | | | OPen-c |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | | | OHex-c |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | | | OCH ₂ Pr-c |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | | | OCH ₂ Bu-c |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | | | OCH ₂ Pen-c |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | | | OCH ₂ Hex-c |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | | | OCH ₂ CH=CH ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | | | OCH ₂ C≡CH |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | | | OCHF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OCHF ₃ | Me | | | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | | | OCH ₂ CHF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OCH ₂ CHF ₃ | Me | | | CF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | | | OCH ₂ CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OCH ₂ CF ₃ | Me | | | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | | | OCH ₂ CN |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | | | OCH ₂ C(=O)OEt |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | | | OCH(Me)C(=O)OEt |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | | | OCH ₂ C(=O)NH ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | | | OCH ₂ C(=O)NHMe |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | | | OCH ₂ C(=O)N(Me) ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | | | OCH ₂ Ph |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | | | OPh |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | | | O(2-Cl)Ph |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | | | O(2-Br)Ph |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | | | O(2-F)Ph |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | | | O(2-Me)Ph |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | | | O(2-OMe)Ph |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | | | O(2-NO ₂)Ph |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | | | O(2-CN)Ph |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | | | O(3-C(=O)OMe)Ph |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | | | O(3-Cl)Ph |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | | | O(3-Br)Ph |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | | | O(3-F)Ph |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | | | O(3-Me)Ph |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | | | O(3-OMe)Ph |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | | | O(3-NO ₂)Ph |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | | | O(3-CN)Ph |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | | | O(3-C(=O)OMe)Ph |

[0072]

【表31】

(41)

特開2002-308857

79

80

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | R ⁹ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|-----------------|----------------|--|
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | O(4-Cl)Ph |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | O(4-Br)Ph |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | O(4-F)Ph |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | O(4-Me)Ph |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | O(4-OMe)Ph |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | O(4-NO ₂)Ph |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | O(4-CN)Ph |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | O(4-C(=O)OMe)Ph |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | OC(=O)Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | OC(=O)Et |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | OC(=O)CH ₂ Ph |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | OC(=O)CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | OC(=O)Ph |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | OSO ₂ Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | OSO ₂ Et |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | OSO ₂ CH ₂ Ph |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | OSO ₂ CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | OSO ₂ Ph |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | SMe |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | SO ₂ Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | SEt |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | SO ₂ Et |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | SPt |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | SO ₂ Pr |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | SPr-i |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | SO ₂ Pr-i |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | SBu-t |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | SO ₂ Bu-t |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | SCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | SO ₂ CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | SCF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | SO ₂ CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | SPb |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | SO ₂ Ph |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | SCH ₂ Ph |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | SO ₂ CH ₂ Ph |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | SCH ₂ C(=O)OEt |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | SO ₂ CH ₂ C(=O)OEt |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | SCH(Me)C(=O)OEt |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | SO ₂ CH(Me)C(=O)OEt |

[0073]

[表32]

(43)

特開2002-308857

83

84

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | R ⁹ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|---------------------------------|----------------|
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ CF ₃ | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Ph | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Ph | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Ph | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Ph | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Ph | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | Et |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OCHF ₂ | Et |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | Et |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OCHF ₂ | Et |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Et |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | F | Et |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Et |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | Et |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Et |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OMe | Et |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Et |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OEt | Et |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Et |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OCHF ₂ | Et |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Et |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | ON | Et |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Et |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Me | Et |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | Pr-i |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OCHF ₂ | Pr-i |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | Pr-i |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OCHF ₂ | Pr-i |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Pr-i |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | F | Pr-i |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Pr-i |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | Pr-i |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Pr-i |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OMe | Pr-i |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Pr-i |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OEt | Pr-i |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Pr-i |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OCHF ₂ | Pr-i |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Pr-i |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CN | Pr-i |

[0075]

[表34]

(44)

特開2002-308857

85

86

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | R ⁹ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|-------------------|----------------|-------------------|
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Pr-i | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Me | Pr-i | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | Pr | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OCHF ₂ | Pr | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | Pr | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OCHF ₂ | Pr | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Pr | F |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | F | Pr | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Pr | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | Pr | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Pr | OMe |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OMe | Pr | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Pr | OEt |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OEt | Pr | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Pr | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OCHF ₂ | Pr | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Pr | CN |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CN | Pr | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Pr | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Me | Pr | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | Bu-t | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OCHF ₂ | Bu-t | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OCHF ₂ | Bu-t | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Bu-t | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Bu-t | F |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Bu-t | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | Bu-t | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Bu-t | OMe |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OMe | Bu-t | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Bu-t | OEt |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OEt | Bu-t | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Bu-t | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Bu-t | CN |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Bu-t | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Me | Bu-t | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Bu-s | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | Bu-s | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Bu-i | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | Bu-i | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Bu | Cl |

[0076]

[表35]

(45)

特開2002-308857

87

88

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | R ⁹ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|-------------------|----------------------|-------------------|
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | Bu | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | 1-Methylbutyl | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | 1-Methylbutyl | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | 1-Ethylpropyl | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | 1-Ethylpropyl | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | 1-Pentyl | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | 1-Pentyl | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | 1-Methylpentyl | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | 1-Methylpentyl | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | 2-Ethylbutyl | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | 2-Ethylbutyl | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | 3,3-Dimethylbutyl | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | 3,3-Dimethylbutyl | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | 1-Hexyl | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | 1-Hexyl | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | 1-Heptyl | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | 1-Heptyl | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | 1-Octyl | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | 1-Octyl | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₃ Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₃ Ph | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Pr-c | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Pen-c | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | Pen-c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Hex-c | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | Hex-c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₃ Pr-c | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OCHF ₂ | CH ₃ Pr-c | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₃ Pr-c | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OCHF ₂ | CH ₃ Pr-c | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₃ Pr-c | F |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | F | CH ₃ Pr-c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₃ Pr-c | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₃ Pr-c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₃ Pr-c | CN |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₃ Pr-c | OH |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₃ Pr-c | OMe |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OMe | CH ₃ Pr-c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₃ Pr-c | OEt |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OEt | CH ₃ Pr-c | CF ₃ |

[0077]

【表36】

(46)

特開2002-308857

89

90

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | a | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|-------------------|--|
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ Pr-c |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ Pr-c |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ Pr-c |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ Pr-c |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ Pr-c |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ Pr-c |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ Pr-c |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OCHF ₃ | CH ₂ Pr-c |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ Pr-c |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CN | CH ₂ Pr-c |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ Pr-c |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Me | CH ₂ Pr-c |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | 1-cyclopropylethyl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | 1-cyclopropylethyl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ (2-Methyl-cyclopropyl) |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₂ (2-Methyl-cyclopropyl) |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ (2,2-Dimethyl-cyclopropyl) |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₂ (2,2-Dimethyl-cyclopropyl) |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ (2-Chloro-cyclopropyl) |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₂ (2-Chloro-cyclopropyl) |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ (2,3-Dichloro-cyclopropyl) |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₂ (2,3-Dichloro-cyclopropyl) |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ (2-Fluoro-cyclopropyl) |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₂ (2-Fluoro-cyclopropyl) |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ (2,2-Difluoro-cyclopropyl) |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₂ (2,2-Difluoro-cyclopropyl) |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ Bu-c |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₂ Bu-c |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ Pen-c |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₂ Pen-c |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ Hex-c |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₂ Hex-c |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ Pr-c |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₂ CH ₂ Pr-c |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ CH=CH ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₂ CH=CH ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ CH=CHCl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₂ CH=CHCl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₂ C≡CH |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OCHF ₃ | CH ₂ C≡CH |

[0078]

[表37]

(47)

特開2002-308857

91

92

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|-------------------|-----------------------|
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₂ C≡CH |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OCHF ₂ | CH ₂ C≡CH |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ C≡CH |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | F | CH ₂ C≡CH |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ C≡CH |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₂ C≡CH |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ C≡CH |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OMe | CH ₂ C≡CH |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ C≡CH |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OEt | CH ₂ C≡CH |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ C≡CH |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OCHF ₂ | CH ₂ C≡CH |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ C≡CH |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CN | CH ₂ C≡CH |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ C≡CH |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Me | CH ₂ C≡CH |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CHMeC≡CH |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CHMeC≡CH |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ C≡CMe |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₂ C≡CMe |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OCHF ₂ | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OCHF ₂ | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | F | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OMe | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OEt | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OCHF ₂ | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CN | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Me | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Me | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CHF ₂ |

[0079]

[表38]

(48)

特開2002-308857

93

94

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | R ⁹ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|-------------------|-------------------------------------|-------------------|
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Et | CHF ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CHF ₂ | Et |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ CHF ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₂ CHF ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ CF ₃ | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₂ CF ₃ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ OH | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₂ OH | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₂ OMe | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OCHF ₂ | CH ₂ OMe | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₂ OMe | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OCHF ₂ | CH ₂ OMe | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ OMe | F |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | F | CH ₂ OMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ OMe | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₂ OMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ OMe | OMe |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OMe | CH ₂ OMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ OMe | OBt |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OBt | CH ₂ OMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ OMe | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OCHF ₂ | CH ₂ OMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ OMe | CN |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CN | CH ₂ OMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ OMe | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Me | CH ₂ OMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ OBt | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₂ OBt | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OH | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₂ CH ₂ OH | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OBt | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₂ CH ₂ OBt | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ NHMe | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₂ NHMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ N(Me) ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₂ N(Me) ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ N(Me)C(=O)Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₂ N(Me)C(=O)Me | CF ₃ |

[0080]

[表39]

(49)

特開2002-308857

95

96

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ^{7a} | R ^{7b} | R ^{8b} |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|-----------------|---|-----------------|
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ N(Me)C(=O)CF ₃ | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₂ N(Me)C(=O)CF ₃ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ N(Me)SO ₂ Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₂ N(Me)SO ₂ Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ N(Me)SO ₂ CHF ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₂ N(Me)SO ₂ CHF ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ N(Me)SO ₂ CF ₃ | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₂ N(Me)SO ₂ CF ₃ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ SMe | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₂ SMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ SO ₂ Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₂ SO ₂ Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ SMe | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₂ CH ₂ SMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ CN | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₂ CN | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ C(=O)OMe | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₂ C(=O)OMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ C(=O)OEt | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₂ C(=O)OEt | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH(Me)C(=O)OMe | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH(Me)C(=O)OMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | C(Me) ₂ C(=O)OMe | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | C(Me) ₂ C(=O)OMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ C(=O)NH ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₂ C(=O)NH ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ C(=O)NHMe | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₂ C(=O)NHMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ C(=O)N(Me) ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₂ C(=O)N(Me) ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ C(=O)Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₂ C(=O)Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ C(=NOMe)Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₂ C(=NOMe)Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ C(=O)CF ₃ | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₂ C(=O)CF ₃ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ C(=O)Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₂ CH ₂ C(=O)Me | CF ₃ |

[0081]

[表40]

(49)

特開2002-308857

95

96

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ^{2a} | R ^{2b} |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|-----------------|---|-----------------|
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ N(Me)C(=O)CF ₃ | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₂ N(Me)C(=O)CF ₃ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ N(Me)SO ₂ Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₂ N(Me)SO ₂ Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ N(Me)SO ₂ CHF ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₂ N(Me)SO ₂ CHF ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ N(Me)SO ₂ CF ₃ | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₂ N(Me)SO ₂ CF ₃ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ SMe | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₂ SMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ SO ₂ Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₂ SO ₂ Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ SMe | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₂ CH ₂ SMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ CN | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₂ CN | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ C(=O)OMe | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₂ C(=O)OMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ C(=O)OEt | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₂ C(=O)OEt | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH(Me)C(=O)OMe | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH(Me)C(=O)OMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | C(Me) ₂ C(=O)OMe | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | C(Me) ₂ C(=O)OMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ C(=O)NH ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₂ C(=O)NH ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ C(=O)NHMe | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₂ C(=O)NHMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ C(=O)N(Me) ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₂ C(=O)N(Me) ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ C(=O)Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₂ C(=O)Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ C(=NOMe)Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₂ C(=NOMe)Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ C(=O)CF ₃ | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₂ C(=O)CF ₃ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ C(=O)Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CH ₂ CH ₂ C(=O)Me | CF ₃ |

[0081]

[表40]

(50)

特開2002-308857

97

98

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | R ⁹ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|---------------------|----------------|-------------------------------------|
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Me | Ph | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Me | Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Et | Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Pr | Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Pr-i | Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Bu-t | Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CH ₂ OMe | Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OCHF ₃ | Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OCHF ₃ | Ph | OCHF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CHF ₃ | Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Ph | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Ph | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Me | Ph | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Ph | Et |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Ph | Pr-i |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Ph | CHF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Ph | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Ph | F |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | Ph | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Ph | OH |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OH | Ph | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Ph | OMe |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OMe | Ph | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Ph | OEt |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OEt | Ph | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Ph | OPr-i |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Ph | OPr |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Ph | OBu-t |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Ph | OCH ₂ Pr-o |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Ph | OCH ₂ CH=CH ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Ph | OCH ₂ C≡CH |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Ph | OCHF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OCHF ₃ | Ph | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Ph | OCH ₂ CHF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Ph | OCH ₂ CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Ph | OCH ₂ C(=O)OMe |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Ph | OCH(Me)C(=O)OMe |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Ph | OC(Me) ₂ C(=O)OMe |

[0082]

【表41】

(51)

特開2002-308857

99

100

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ^{8a} | R ^{8b} |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|-----------------|-----------------|--------------------------------------|
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Ph | OC(=O)Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Ph | OC(=O)Et |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Ph | OC(=O)CH ₂ Ph |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Ph | OC(=O)CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Ph | OC(=O)Ph |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Ph | OSO ₂ Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Ph | OSO ₂ Et |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Ph | OSO ₂ CH ₂ Ph |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Ph | OSO ₂ CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Ph | OSO ₂ Ph |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Ph | SEt |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Ph | SO ₂ Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Ph | SEt |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Ph | SO ₂ Et |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Ph | SP ₂ -I |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Pt | SO ₂ Pr-I |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Ph | SP ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Ph | SO ₂ Pr |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Ph | SBu-t |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Ph | SO ₂ Bu-t |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Pt | SCHF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Pt | SO ₂ CHF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Pt | NH ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Pt | NHMe |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Pt | N(Me) ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Pt | NHC(=O)Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Pt | N(Me)C(=O)Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Ph | NHSO ₂ Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Ph | N(Me)SO ₂ Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Ph | NHSO ₂ CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Ph | N(Me)SO ₂ CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Ph | NHPh |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Ph | N(Me)Ph |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Ph | CN |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Ph | C(=O)Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Ph | C(=O)OMe |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Ph | C(=O)NH ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Ph | C(=O)NHMe |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Ph | C(=O)N(Me) ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Ph | Imidazol-1-yl |

【0083】

【表42】

(52)

特開2002-308857

101

102

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ^{7a} | R ^{7b} | R ⁸ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|---------------------------------|------------------------------|---------------------------------------|
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Ph | Pyrazol-1-yl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Ph | 1,2,4-Triazol-1-yl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Ph | 1,2,4-Triazol-4-yl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Ph | Tetrazol-1-yl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Ph | Tetrazol-5-yl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Ph | (4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl)oxy |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Ph | (4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl)sulfonyl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ CF ₃ | Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | (3-Cl)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | (2-F)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | (2-OMe)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | (2-Me)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | (2-NO ₂)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | (2-CN)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | (2-C(=O)Me)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | (2-C(=O)OMe)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | (2-C(=O)OBn)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | (2-C(=O)OPr-i)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | (2-C(=O)NH ₂)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | (2-C(=O)NHMe)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | (2-C(=O)NMe ₂)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | (3-Cl)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | (3-F)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | (3-OMe)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | (3-Me)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | (3-NO ₂)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | (3-CN)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | (3-C(=O)Me)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | (3-C(=O)OMe)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | (3-C(=O)OBn)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | (3-C(=O)OPr-i)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | (3-C(=O)NH ₂)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | (3-C(=O)NHMe)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | (3-C(=O)NMe ₂)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | (4-Cl)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | (4-F)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | (4-OMe)Ph | Cl |

[0084]

40 【表43】

(53)

特開2002-308857

103

104

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | R ⁶ | R ²⁰ | R ²⁸ | R ³⁰ | |
|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|-----------------|-----------------|------------------------------------|-------------------------------------|
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | (4-Me)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | (4-NO ₂)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | (4-CN)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | (4-C(=O)Me)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | (4-C(=O)OMe)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | (4-C(=O)OBu)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | (4-C(=O)OPr-i)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | (4-C(=O)NHMe)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | (4-C(=O)NMe ₂)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Pyrimidin-2-yl | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Thiophen-2-yl | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Furan-2-yl | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | SO ₂ Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | SO ₂ Et | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | SO ₂ Pr-i | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | SO ₂ CH ₂ Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | SO ₂ CHF ₃ | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | SO ₂ CF ₃ | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | SO ₂ Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | B | CF ₃ | C(=O)Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | B | CF ₃ | C(=O)Et | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | B | CF ₃ | C(=O)Pr-i | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | B | CF ₃ | C(=O)Bu-t | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | B | CF ₃ | C(=O)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | B | CF ₃ | C(=O)CH ₂ Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | B | CF ₃ | C(=O)CH ₂ Cl | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | B | CF ₃ | C(=O)CHCl ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | B | CF ₃ | C(=O)CF ₃ | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | B | CF ₃ | C(=O)OMe | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | B | CF ₃ | C(=O)OPh | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | B | CF ₃ | C(=O)OCH ₂ Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | M | B | CF ₃ | C(=O)NHMe | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | B | CF ₃ | C(=O)N(Me) ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | B | B | CF ₃ | C(=O)NHPh | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | NH ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | | -(CH ₂) ₂ O- |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | | -(CH ₂) ₂ O- |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | | -(CH ₂) ₂ S- |

【0085】

40 【表44】

(54)

特開2002-308857

105

106

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | R ⁹ | R ¹⁰ |
|----------------|---------------------------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|----------------------------------|----------------|---|----------------------------------|
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | | (CH ₂) ₉ SO ₂ | |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | | (CH ₂) ₉ O | |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | | (CH ₂) ₉ O | |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | | (CH ₂) ₉ S | |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | | (CH ₂) ₉ SO ₂ | |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OMe | | (CH ₂) ₉ | |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OCH ₂ CF ₃ | | (CH ₂) ₉ | |
| H | H | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | | Cl |
| Me | H | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | | Cl |
| Me | H | Me | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | | Cl |
| Me | Me | Me | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | Me | H | CF ₃ | Me | | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | Et | H | CF ₃ | Me | | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | Pr | H | CF ₃ | Me | | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | Me | Me | CF ₃ | Me | | Cl |
| Me | Et | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | | Cl |
| Et | Et | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | | Cl |
| Me | Pr-i | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | | Cl |
| Me | Pr | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | | Cl |
| Me | Pr-c | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | | Cl |
| Me | CH ₂ Pr-c | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | | Cl |
| | (CH ₂) ₉ | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | | Cl |
| | (CH ₂) ₉ | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | | Cl |
| | (CH ₂) ₉ | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | | Cl |
| | (CH ₂) ₉ | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | | Cl |
| H | (CH ₂) ₉ | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | | Cl |
| H | (CH ₂) ₉ | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | | Cl |
| H | (CH ₂) ₉ | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | | Cl |
| H | (CH ₂) ₉ | H | H | 1 | H | H | CF ₃ | Me | | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | H | | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OCH ₂ CF ₃ | H | | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OCH ₂ CF ₃ | H | | OCH ₂ CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CH ₂ CF ₃ | H | | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | H | | F |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | H | | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | H | | OMe |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | H | | OEt |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | H | | OCH ₂ CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | H | | CN |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | H | | Me |

【0086】

40 【表45】

(55)

特開2002-308857

107

108

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | R ⁹ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|-------------------|----------------|-------------------|
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Me | Me | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Me | Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | Me | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Et | Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | Me | Et |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Pr-i | Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | Me | Pr-i |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Bu-t | Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | Me | Bu-t |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CHF ₃ | Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | Me | CHF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OCHF ₂ | Me | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OCHF ₂ | Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | Me | OCHF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OCHF ₃ | Me | OCHF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | F |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | F | Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | OH |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OH | Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | OMe |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OMe | Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | OEt |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OEt | Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | OPr-i |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | OPr |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | OBu-t |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | OBu-s |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | OBu-a |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | OBu |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | O(2-Pen) |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | O(3-Pen) |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | OPen-n |
| Me | Me | H | K | 0 | N | H | CF ₃ | Me | O(2-Hex) |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | O(3-Hex) |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | OHex-n |

【0087】

40 【表46】

(56)

特開2002-308857

109

110

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ²³ | R ²⁰ | U ²⁰ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|-----------------------------------|-----------------|--|
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | OPen-c |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | OHex-c |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | OCH ₂ Pr-c |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | OCH ₂ Bu-c |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | OCH ₂ Pen-c |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | OCH ₂ Hex-c |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | OCH ₂ CH=CH ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | OCH ₂ C ⁺ CH |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | OCHF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OCHF ₃ | Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | OCH ₂ CHF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OCH ₂ CHF ₃ | Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | OCH ₂ CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OCH ₂ CF ₃ | Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | OCH ₂ CN |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | OCH ₂ C(=O)OEt |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | OCH ₂ C(=O)NEt ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | OCH ₂ C(=O)NHMe |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | OCH ₂ C(=O)N(Me) ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | OCH ₂ Ph |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | OPh |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | O(2-CDPh) |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | O(2-Br)Ph |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | O(2-F)Ph |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | O(2-Me)Ph |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | O(2-OMe)Ph |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | O(2-NO ₂)Ph |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | O(2-CN)Ph |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | O(2-C(=O)OMe)Ph |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | O(3-Cl)Ph |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | O(3-Br)Ph |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | O(3-F)Ph |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | O(3-Me)Ph |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | O(3-OMe)Ph |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | O(3-NO ₂)Ph |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | O(3-CN)Ph |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | O(3-C(=O)OMe)Ph |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | O(4-Cl)Ph |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | O(4-Br)Ph |

[0088]

40 【表47】

(57)

特開2002-308857

111

112

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | R ⁹ | R ¹⁰ | R ¹¹ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|-----------------|----------------|----------------|--|-----------------|
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | | O(4-F)Ph | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | | O(4-Me)Ph | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | | O(4-OMe)Ph | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | | O(4-NO ₂)Ph | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | | O(4-CN)Ph | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | | O(4-C(=O)OMe)Ph | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | | OC(=O)Me | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | | OC(=O)Et | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | | OC(=O)CH ₂ Ph | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | | OC(=O)CH ₂ Ph | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | | OC(=O)CH ₂ Ph | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | | OC(=O)CH ₂ Ph | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | | OSO ₂ Me | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | | OSO ₂ Et | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | | OSO ₂ CH ₂ Ph | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | | OSO ₂ CF ₃ | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | | OSO ₂ Ph | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | | OMe | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | | SO ₃ Me | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | | SEt | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | | SO ₃ Et | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | | SPr | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | | SO ₃ Pr | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | | SPr-i | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | | SO ₃ Pr-i | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | | SBu-t | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | | SO ₃ Bu-t | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | | SCHE ₂ | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | | SO ₃ CH ₂ Ph | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | | SCF ₃ | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | | SO ₃ CF ₃ | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | | STh | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | | SO ₃ Ph | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | | SCF ₃ Ph | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | | SO ₃ CH ₂ Ph | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | | SCH ₂ C(=O)OEt | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | | SO ₃ CH ₂ C(=O)OEt | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | | SCH(Me)C(=O)OEt | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | | SO ₃ CH(Me)C(=O)OEt | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | | SCH ₂ C(=O)NH ₂ | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | | SO ₃ CH ₂ C(=O)NH ₂ | |

【0089】

40 【表48】

(58)

特開2002-308857

113

114

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | R ⁶ | R ²⁰ | R ²¹ | R ²² |
|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|-----------------|-----------------|---|
| Me | Me | H | H | O | H | CF ₃ | Me | SCCH ₂ C(=O)NHMe |
| Me | Me | H | H | O | H | CF ₃ | Me | SO ₂ (CH ₂ C(=O)NHMe) |
| Me | Me | H | H | O | H | CF ₃ | Me | SCCH ₂ C(=O)N(Me) ₂ |
| Me | Me | H | H | O | H | CF ₃ | Me | SO ₂ CH ₂ C(=O)N(Me) ₂ |
| Me | Me | H | H | O | H | CF ₃ | Me | NH ₂ |
| Me | Me | H | H | O | H | CF ₃ | Me | NHMe |
| Me | Me | H | H | O | H | CF ₃ | Me | N(Me) ₂ |
| Me | Me | H | H | O | H | CF ₃ | Me | NHC(=O)Me |
| Me | Me | H | H | O | H | CF ₃ | Me | N(Me)C(=O)Me |
| Me | Me | H | H | O | H | CF ₃ | Me | NHCO ₂ Me |
| Me | Me | H | H | O | H | CF ₃ | Me | N(Me)SO ₂ Me |
| Me | Me | H | H | O | H | CF ₃ | Me | NHCO ₂ CHF ₃ |
| Me | Me | H | H | O | H | CF ₃ | Me | N(Me)SO ₂ CHF ₃ |
| Me | Me | H | H | O | H | CF ₃ | Me | NHCO ₂ CF ₃ |
| Me | Me | H | H | O | H | CF ₃ | Me | N(Me)SO ₂ CF ₃ |
| Me | Me | H | H | O | H | CF ₃ | Me | NHPh |
| Me | Me | H | H | O | H | CF ₃ | Me | N(Me)Ph |
| Me | Me | H | H | O | H | CF ₃ | Me | CN |
| Me | Me | H | H | O | H | CF ₃ | Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | O | H | CF ₃ | Me | C(=O)OMe |
| Me | Me | H | H | O | H | CF ₃ | Me | C(=O)OCH ₂ Ph |
| Me | Me | H | H | O | H | CF ₃ | Me | C(=O)OPh |
| Me | Me | H | H | O | H | CF ₃ | Me | C(=O)NH ₂ |
| Me | Me | H | H | O | H | CF ₃ | Me | C(=O)NHMe |
| Me | Me | H | H | O | H | CF ₃ | Me | C(=O)N(Me) ₂ |
| Me | Me | H | H | O | H | CF ₃ | Me | C(=O)Me |
| Me | Me | H | H | O | H | CF ₃ | Me | C(=O)CF ₃ |
| Me | Me | H | H | O | H | CF ₃ | Me | C(=O)CH ₂ Ph |
| Me | Me | H | H | O | H | CF ₃ | Me | C(=O)Ph |
| Me | Me | H | H | O | H | CF ₃ | Me | Me |
| Me | Me | H | H | O | H | CF ₃ | Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | O | H | CF ₃ | Me | Et |
| Me | Me | H | H | O | H | CF ₃ | Me | Pr-i |
| Me | Me | H | H | O | H | CF ₃ | Me | Pr |
| Me | Me | H | H | O | H | CF ₃ | Me | CH ₂ OMe |
| Me | Me | H | H | O | H | CF ₃ | Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | O | H | CF ₃ | Me | CHF ₃ |
| Me | Me | H | H | O | H | CF ₃ | Me | Ph |
| Me | Me | H | H | O | H | CF ₃ | Me | Cl |
| Me | Me | H | H | O | H | CF ₃ | Me | Me |

[0090]

49 [表49]

(59)

特開2002-308857

115

116

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | R ⁹ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|-------------------|----------------|
| Me | Me | H | H | O | H | H | Ph | Me |
| Me | Me | H | H | O | H | H | Ph | Me |
| Me | Me | H | H | O | H | H | Ph | Me |
| Me | Me | H | H | O | H | H | Ph | Me |
| Me | Me | H | H | O | H | H | Cl | Et |
| Me | Me | H | H | O | H | H | OCHF ₂ | Et |
| Me | Me | H | H | O | H | H | Cl | Et |
| Me | Me | H | H | O | H | H | OCHF ₂ | Et |
| Me | Me | H | H | O | H | H | CF ₃ | Et |
| Me | Me | H | H | O | H | H | F | Et |
| Me | Me | H | H | O | H | H | CF ₃ | Et |
| Me | Me | H | H | O | H | H | Cl | Et |
| Me | Me | H | H | O | H | H | CF ₃ | Et |
| Me | Me | H | H | O | H | H | CF ₃ | Et |
| Me | Me | H | H | O | H | H | OMe | Et |
| Me | Me | H | H | O | H | H | CF ₃ | Et |
| Me | Me | H | H | O | H | H | OBt | Et |
| Me | Me | H | H | O | H | H | CF ₃ | Et |
| Me | Me | H | H | O | H | H | OCHF ₂ | Et |
| Me | Me | H | H | O | H | H | CF ₃ | Et |
| Me | Me | H | H | O | H | H | CN | Et |
| Me | Me | H | H | O | H | H | CF ₃ | Et |
| Me | Me | H | H | O | H | H | Me | Et |
| Me | Me | H | H | O | H | H | Cl | Pr-i |
| Me | Me | H | H | O | H | H | OCHF ₂ | Pr-i |
| Me | Me | H | H | O | H | H | Cl | Pr-i |
| Me | Me | H | H | O | H | H | OCHF ₂ | Pr-i |
| Me | Me | H | H | O | H | H | CF ₃ | Pr-i |
| Me | Me | H | H | O | H | H | F | Pr-i |
| Me | Me | H | H | O | H | H | CF ₃ | Pr-i |
| Me | Me | H | H | O | H | H | Cl | Pr-i |
| Me | Me | H | H | O | H | H | CF ₃ | Pr-i |
| Me | Me | H | H | O | H | H | OMe | Pr-i |
| Me | Me | H | H | O | H | H | CF ₃ | Pr-i |
| Me | Me | H | H | O | H | H | OBt | Pr-i |
| Me | Me | H | H | O | H | H | CF ₃ | Pr-i |
| Me | Me | H | H | O | H | H | OCHF ₂ | Pr-i |
| Me | Me | H | H | O | H | H | CF ₃ | Pr-i |
| Me | Me | H | H | O | H | H | CN | Pr-i |
| Me | Me | H | H | O | H | H | CF ₃ | Pr-i |
| Me | Me | H | H | O | H | H | Me | Pr-i |
| Me | Me | H | H | O | H | H | Me | Pr-i |

[0091]

[表50]

(60)

特開2002-308857

117

118

| R ³ | R ² | R ¹ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | R ⁹ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|-------------------|----------------|-------------------|
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | Pr | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OCHF ₂ | Pr | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | Pr | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OCHF ₂ | Pr | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Pr | F |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | F | Pr | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Pr | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | Pr | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Pr | OMe |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OMe | Pr | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Pr | OEt |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OEt | Pr | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Pr | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OCHF ₂ | Pr | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Pr | CN |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CN | Pr | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Pr | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Me | Pr | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | Bu-t | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OCHF ₂ | Bu-t | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OCHF ₂ | Bu-t | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Bu-t | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Bu-t | F |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Bu-t | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | Bu-t | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Bu-t | OMe |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OMe | Bu-t | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Bu-t | OEt |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OEt | Bu-t | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Bu-t | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Bu-t | CN |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Bu-t | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Me | Bu-t | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Bu-s | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | Bu-s | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Bu-i | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | Bu-i | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Bu | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | Bu | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | 1-Methylbutyl | Cl |

[0092]

【表51】

(61)

特開2002-308857

119

120

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ²⁸ | R ³⁰ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|-------------------|----------------------|-------------------|
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | 1-Methylbutyl | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | 1-Ethylpropyl | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | 1-Ethylpropyl | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | 1-Pentyl | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | 1-Pentyl | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | 1-Methylpentyl | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | 1-Methylpentyl | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | 2-Ethylbutyl | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | 2-Ethylbutyl | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | 3,3-Dimethylbutyl | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | 3,3-Dimethylbutyl | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | 1-Hexyl | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | 1-Hexyl | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | 1-Heptyl | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | 1-Heptyl | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | 1-Octyl | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | 1-Octyl | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | CH ₂ Ph | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Pr-c | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Pen-c | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | Pen-c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Hex-c | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | Hex-c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | CH ₂ Pr-c | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OCHF ₂ | CH ₂ Pr-c | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | CH ₂ Pr-c | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OCHF ₂ | CH ₂ Pr-c | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ Pr-c | F |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | F | CH ₂ Pr-c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ Pr-c | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | CH ₂ Pr-c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ Pr-c | CN |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ Pr-c | OH |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ Pr-c | OMe |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OMe | CH ₂ Pr-c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ Pr-c | OEt |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OEt | CH ₂ Pr-c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ Pr-c | OPr-i |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ Pr-c | OPr |

[0093]

【表52】

(62)

特開2002-308857

121

122

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ²⁰ | R ²¹ | R ²² |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|-------------------|--|-----------------------|
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ Pr-c | OBu-t |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ Pr-c | OOH ₂ Pr-c |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ Pr-c | OOH ₂ Bu-c |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ Pr-c | OPen-c |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ Pr-c | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OCHF ₂ | CH ₂ Pr-c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ Pr-c | CN |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CN | CH ₂ Pr-c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ Pr-c | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Me | CH ₂ Pr-c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | 1-cyclopropylethyl | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | 1-cyclopropylethyl | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ (2-Methyl-cyclopropyl) | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | CH ₂ (2-Methyl-cyclopropyl) | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ (2,2-Dimethyl-cyclopropyl) | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | CH ₂ (2,2-Dimethyl-cyclopropyl) | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ (2-Chloro-cyclopropyl) | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | CH ₂ (2-Chloro-cyclopropyl) | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ (2,2-Dichloro-cyclopropyl) | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | CH ₂ (2,2-Dichloro-cyclopropyl) | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ (2-Fluoro-cyclopropyl) | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | CH ₂ (2-Fluoro-cyclopropyl) | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ (2,2-Difluoro-cyclopropyl) | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | CH ₂ (2,2-Difluoro-cyclopropyl) | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ Bu-c | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | CH ₂ Bu-c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ Pen-c | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | CH ₂ Pen-c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ Hex-c | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | CH ₂ Hex-c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ Pr-c | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | CH ₂ CH ₂ Pr-c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ CH=CH ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | CH ₂ CH=CH ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ CH=CHCl | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | CH ₂ CH=CHCl | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | CH ₂ C≡CH | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OCHF ₂ | CH ₂ C≡CH | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | CH ₂ C≡CH | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OCHF ₂ | CH ₂ C≡CH | OCHF ₂ |

【0094】

【表53】

(63)

特開2002-308857

123

124

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | R ⁹ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|-------------------|-----------------------|-------------------|
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ C≡CH | F |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | F | CH ₂ C≡CH | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ C≡CH | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | CH ₂ C≡CH | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ C≡CH | OMe |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OMe | CH ₂ C≡CH | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ C≡CH | OBt |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OBt | CH ₂ C≡CH | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ C≡CH | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OCHF ₂ | CH ₂ C≡CH | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ C≡CH | CN |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CN | CH ₂ C≡CH | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ C≡CH | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Me | CH ₂ C≡CH | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ C≡CH | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | CH ₂ C≡CH | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ C≡CMo | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | CH ₂ C≡CMo | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | CHF ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OCHF ₂ | CHF ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | CHF ₂ | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OCHF ₂ | CHF ₂ | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CHF ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | CHF ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CHF ₂ | F |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | F | CHF ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CHF ₂ | OMe |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OMe | CHF ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CHF ₂ | OBt |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OBt | CHF ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CHF ₂ | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OCHF ₂ | CHF ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CHF ₂ | CN |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CN | CHF ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CHF ₂ | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Me | CHF ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Me | CHF ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | CHF ₂ | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Bt | CHF ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | CHF ₂ | Bt |

[0095]

【表54】

(64)

特開2002-308857

125

126

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | R ⁹ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|-------------------|---|-------------------|
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ CHF ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | CH ₂ CHF ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ CF ₃ | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | CH ₂ CF ₃ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ OH | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | CH ₂ OH | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | CH ₂ OMe | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OCHF ₂ | CH ₂ OMe | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | CH ₂ OMe | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OCHF ₂ | CH ₂ OMe | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ OMe | F |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | F | CH ₂ OMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ OMe | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | CH ₂ OMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ OMe | OMe |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OMe | CH ₂ OMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ OMe | OEt |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OEt | CH ₂ OMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ OMe | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OCHF ₂ | CH ₂ OMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ OMe | CN |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CN | CH ₂ OMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ OMe | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Me | CH ₂ OMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ OBt | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | CH ₂ OBt | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OH | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | CH ₂ CH ₂ OH | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OBt | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | CH ₂ CH ₂ OBt | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ NHMe | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | CH ₂ NHMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ N(Me) ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | CH ₂ N(Me) ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ N(Me)C(=O)Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | CH ₂ N(Me)C(=O)Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ N(Me)C(=O)CF ₃ | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | CH ₂ N(Me)C(=O)CF ₃ | CF ₃ |

【0096】

【表55】

(65)

特開2002-308857

127

128

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ^{2a} | R ^{2b} | R ^{2c} |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|-----------------|--|-----------------|
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ N(Me)SO ₂ Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | CH ₂ N(Me)SO ₂ Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ N(Me)SO ₂ CH ₂ F | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | CH ₂ N(Me)SO ₂ CH ₂ F | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ N(Me)SO ₂ CF ₃ | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | CH ₂ N(Me)SO ₂ CF ₃ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ SMc | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | CH ₂ SMc | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ SO ₂ Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | CH ₂ SO ₂ Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ SMc | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | CH ₂ CH ₂ SMc | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ CN | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | CH ₂ CN | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ C(=O)OMe | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | CH ₂ C(=O)OMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ C(=O)ORt | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | CH ₂ C(=O)ORt | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH(Me)C(=O)OMe | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | CH(Me)C(=O)OMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | C(Me) ₂ C(=O)OMe | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | C(Me) ₂ C(=O)OMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ C(=O)NH ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | CH ₂ C(=O)NH ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ C(=O)NHMe | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | CH ₂ C(=O)NHMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ C(=O)N(Me) ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | CH ₂ C(=O)N(Me) ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ C(=O)Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | CH ₂ C(=O)Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | K | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ C(=NO ₂ Me)Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | CH ₂ C(=NO ₂ Me)Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ C(=O)CF ₃ | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | CH ₂ C(=O)CF ₃ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ C(=O)Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | CH ₂ CH ₂ C(=O)Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Me | Ph | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Me | Ph | Cl |

[0097]

[表56]

(66)

特開2002-308857

129

130

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | R ⁹ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|---------------------|----------------|-------------------------------------|
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Et | Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Pr | Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Pr-i | Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Bu-t | Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CH ₂ OMe | Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OCHF ₂ | Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OCHF ₂ | Ph | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CHF ₂ | Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Ph | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Ph | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Me | Ph | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Ph | Et |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Ph | Pr-i |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Ph | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Ph | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Ph | F |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | Ph | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Ph | OH |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OH | Ph | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Ph | OMe |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OMe | Ph | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Ph | OEt |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OEt | Ph | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Ph | OPr-i |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Ph | OPr |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Ph | OBu-t |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Ph | OCH ₂ Pr-c |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Ph | OCH ₂ CH=CH ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Ph | OCH ₂ C=CH |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Ph | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OCHF ₂ | Ph | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Ph | OCH ₂ CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Ph | OCH ₂ CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Ph | OCH ₂ C(=O)OMe |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Ph | OCH(Me)C(=O)OMe |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Ph | OC(Me) ₂ C(=O)OMe |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Ph | OC(=O)Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Ph | OC(=O)Et |

[0098]

【表57】

131

132

[illegible]

【0099】

【表58】

133

134

[illegible]

【0100】

【表59】

(69)

特開2002-308857

135

136

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | R ⁹ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|-----------------|--|----------------|
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | (4-ON)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | (4-C(=O)Me)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | (4-C(=O)OMe)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | (4-C(=O)OEt)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | (4-C(=O)OPr-i)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | (4-C(=O)NHMe)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | (4-C(=O)NMe ₂)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Pyrimidin-2-yl | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Thiophen-2-yl | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Furan-2-yl | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | SO ₂ Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | SO ₂ Et | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | SO ₂ Pr-i | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | SO ₂ CH ₂ Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | SO ₂ CH ₂ Cl | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | SO ₂ Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | C(=O)Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | C(=O)Et | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | C(=O)Pr-i | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | C(=O)Bu-t | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | C(=O)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | C(=O)CH ₂ Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | C(=O)CH ₂ Cl | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | C(=O)CHCl ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | C(=O)CF ₃ | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | C(=O)OMe | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | C(=O)OPh | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | C(=O)OCH ₂ Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | C(=O)NHMe | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | C(=O)N(Me) ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | C(=O)NHPh | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | NH ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | -(CH ₂) ₂ O- | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | -(CH ₂) ₃ O- | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | -(CH ₂) ₂ S- | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | -(CH ₂) ₂ SO ₂ - | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | -(CH ₂) ₂ O- | |

[0101]

[表60]

(70)

特開2002-308857

137

138

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | R ⁹ |
|----------------|-----------------------------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|-------------------|----------------|----------------|
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OMe | | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OCHF ₂ | | |
| H | H | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | Cl |
| Me | H | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | Cl |
| Me | H | Me | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | Cl |
| Me | Me | Me | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | Me | H | CF ₃ | Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | Et | H | CF ₃ | Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | Pr-i | H | CF ₃ | Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | Me | Me | CF ₃ | Me | Cl |
| Me | Et | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | Cl |
| Et | Et | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | Cl |
| Me | Pr-i | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | Cl |
| Me | Pr | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | Cl |
| Me | Pr-c | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | Cl |
| Me | CH ₂ Pr-c | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | Cl |
| | -(CH ₂) ₇ | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | Cl |
| | -(CH ₂) ₈ | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | Cl |
| | -(CH ₂) ₉ | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | Cl |
| | -(CH ₂) ₁₀ | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | Cl |
| H | -(CH ₂) ₇ | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | Cl |
| H | -(CH ₂) ₈ | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | Cl |
| H | -(CH ₂) ₉ | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | Cl |
| H | -(CH ₂) ₁₀ | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | Cl |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | H | H | H |

【0102】

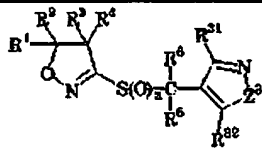
【表61】

(71)

特開2002-308857

139

140

|  | | | | | | | | | |
|---|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|----------------|-------------------|----------------------------------|
| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | Z ¹ | R ¹¹ | R ¹² |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | Me | F |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | Me | OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | Me | OEt |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | Me | OPr-i |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | Me | OPh |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | Me | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | Me | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | Me | CN |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | OCHF ₂ | F |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | OCHF ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | OCHF ₂ | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | OCHF ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | OCHF ₂ | CN |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | F |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | OEt |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | OPr-i |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | OPh |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | SMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | SOMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | SO ₂ Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | SEt |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | SOEt |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | SO ₂ Et |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | SPr-i |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | SOPr-i |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | SO ₂ Pr-i |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | SPh |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | SOPh |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | SO ₂ Ph |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | SCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | SOCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | SO ₂ CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | SCF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | SOCF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | SO ₂ CF ₃ |

[0103]

[表62]

(72)

特開2002-308857

141

142

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | Z ¹ | R ⁷ | R ⁸ |
|----------------------------------|----------------------------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|----------------|-----------------|---|
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | NH ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | NHC(=O)Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | NHC(=O)Ph |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | NHC(=O)CH ₂ Ph |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | NHC(=O)CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | NHSO ₂ Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | NHSO ₂ Ph |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | NHSO ₂ CH ₂ Ph |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | NHSO ₂ CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | NHMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | NHPh |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | N(Me)C(=O)Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | N(Me)C(=O)Ph |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | N(Me)C(=O)CH ₂ Ph |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | N(Me)C(=O)CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | N(Me)SO ₂ Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | N(Me)SO ₂ Ph |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | N(Me)SO ₂ CH ₂ Ph |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | N(Me)SO ₂ CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | N(Me) ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | N(Me)Ph |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | CN |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | Ph | Me |
| H | H | H | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | Me |
| Me | H | H | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | Me |
| Me | H | Me | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | Me |
| Me | Me | Me | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | Me | H | O | CF ₃ | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | Et | H | O | CF ₃ | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | Pr-i | H | O | CF ₃ | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | Me | Me | O | CF ₃ | Me |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | Me |
| Et | Et | H | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | Me |
| Me | Pr-i | H | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | Me |
| Me | Pr | H | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | Me |
| Me | Pr-c | H | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | Me |
| Me | CH ₂ Pr-c | H | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | Me |
| (CH ₂) ₇ | | H | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | Me |
| (CH ₂) ₈ | | H | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | Me |
| (CH ₂) ₉ | | H | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | Me |
| (CH ₂) ₁₀ | | H | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | Me |
| H | -(CH ₂) ₈ | H | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | Me |
| H | -(CH ₂) ₉ | H | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | Me |

[0104]

[表63]

(73)

特開2002-308857

143

144

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | Z ¹ | R ⁷ | R ⁸ |
|----------------|----------------------------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|----------------|-------------------|----------------------------------|
| H | -(CH ₂) ₅ | | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | Me |
| H | -(CH ₂) ₆ | | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | Me | F |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | Me | OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | Me | OEt |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | Me | OPr-i |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | Me | OPh |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | Me | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | OCHF ₂ | F |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | OCHF ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | OCHF ₂ | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | OCHF ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | OCHF ₂ | CN |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | F |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | OEt |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | OPh |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | SMe |
| Me | Me | H | H | 3 | H | H | S | CF ₃ | SOMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | SO ₂ Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | SEt |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | SOEt |
| Me | Me | H | H | 3 | H | H | S | CF ₃ | SO ₂ Et |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | SPr-i |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | SOPr-i |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | SO ₂ Pr-i |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | SPh |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | SOPh |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | SO ₂ Ph |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | SOCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | SOCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | SO ₂ CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | SCF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | SOCF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | SO ₂ CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | NH ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | NHC(=O)Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | NHC(=O)Ph |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | NHC(=O)CH ₂ Ph |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | NHC(=O)CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | NHSO ₂ Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | NHSO ₂ Ph |

【0105】

【表64】

(74)

特開2002-308857

145

146

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | Z ¹ | R ³¹ | R ³² |
|---------------------------------|----------------------------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|----------------|-----------------|---------------------------------------|
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | NHSO ₂ CHF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | NHSO ₂ CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | NHMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | NHPh |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | N(Me)C(=O)Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | N(Me)C(=O)Ph |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | N(Me)C(=O)CH ₂ Ph |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | N(Me)C(=O)CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | N(Me)SO ₂ Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | N(Me)SO ₂ Ph |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | N(Me)SO ₂ CHF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | N(Me)SO ₂ CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | N(Me) ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | N(Me)Ph |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | CN |
| H | H | H | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | Cl |
| Me | H | H | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | Cl |
| Me | H | Me | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | Cl |
| Me | Me | Me | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | Me | H | S | CF ₃ | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | Et | H | S | CF ₃ | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | Pr-i | H | S | CF ₃ | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | Me | Me | S | CF ₃ | Cl |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | Cl |
| Et | Et | H | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | Cl |
| Me | Pr-i | H | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | Cl |
| Me | Pr | H | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | Cl |
| Me | Pr-c | H | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | Cl |
| Me | CH ₂ Pr-c | H | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | Cl |
| (CH ₂) ₇ | | H | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | Cl |
| (CH ₂) ₇ | | H | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | Cl |
| (CH ₂) ₇ | | H | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | Cl |
| (CH ₂) ₇ | | H | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | Cl |
| H | -(CH ₂) ₇ | | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | Cl |
| H | -(CH ₂) ₄ | | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | Cl |
| H | -(CH ₂) ₆ | | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | Cl |
| H | -(CH ₂) ₆ | | H | 2 | H | H | S | CF ₃ | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | Me | F |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | Me | OMe |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | Me | OEt |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | Me | OPr-i |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | Me | OPh |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | Me | OCHF ₃ |

【0106】

【表65】

(75)

特開2002-308857

| 147 | | | | | 148 | | | | |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|----------------|-------------------|---------------------------------------|
| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | Z ¹ | R ²¹ | R ²² |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | Me | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | Me | CN |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | OCHF ₂ | F |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | OCHF ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | OCHF ₂ | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | OCHF ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | OCHF ₂ | CN |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | CF ₃ | F |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | CF ₃ | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | CF ₃ | OMe |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | CF ₃ | OEt |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | CF ₃ | OPr-i |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | CF ₃ | OPh |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | CF ₃ | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | CF ₃ | SMe |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | CF ₃ | SO ₂ Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | CF ₃ | SEt |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | CF ₃ | SO ₂ Et |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | CF ₃ | SPr-i |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | CF ₃ | SO ₂ Pr-i |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | CF ₃ | SPh |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | CF ₃ | SO ₂ Ph |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | CF ₃ | SCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | CF ₃ | SO ₂ CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | CF ₃ | SCF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | CF ₃ | SO ₂ CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | CF ₃ | NH ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | CF ₃ | NHC(=O)Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | CF ₃ | NHC(=O)Ph |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | CF ₃ | NHC(=O)CH ₂ Ph |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | CF ₃ | NHC(=O)CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | CF ₃ | NHSO ₂ Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | CF ₃ | NHSO ₂ Ph |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | CF ₃ | NHSO ₂ CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | CF ₃ | NHSO ₂ CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | CF ₃ | NHMe |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | CF ₃ | NHPh |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | CF ₃ | N(Me)C(=O)Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | CF ₃ | N(Me)C(=O)Ph |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | CF ₃ | N(Me)C(=O)CH ₂ Ph |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | CF ₃ | N(Me)C(=O)CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | CF ₃ | N(Me)SO ₂ Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | CF ₃ | N(Me)SO ₂ Ph |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | CF ₃ | N(Me)SO ₂ CHF ₂ |

[0107]

40 [表66]

(76)

特開2002-308857

149

150

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | Z ⁷ | R ⁸¹ | R ⁸² |
|-----------------------------------|------------------------------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|----------------|-------------------|--------------------------------------|
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | CF ₃ | N(Me)SO ₂ CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | CF ₃ | N(Me) ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | CF ₃ | N(Me)Ph |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | CF ₃ | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | CF ₃ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | CF ₃ | CN |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | Ph | Me |
| H | H | H | H | 1 | H | H | O | CF ₃ | Me |
| Me | H | H | H | 1 | H | H | O | CF ₃ | Me |
| Me | H | Me | H | 1 | H | H | O | CF ₃ | Me |
| Me | Me | Me | H | 1 | H | H | O | CF ₃ | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | Me | H | O | CF ₃ | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | Et | H | O | CF ₃ | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | Pr-i | H | O | CF ₃ | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | Me | Me | O | CF ₃ | Me |
| Me | Et | H | H | 1 | H | H | O | CF ₃ | Me |
| Et | Et | H | H | 1 | H | H | O | CF ₃ | Me |
| Me | Pr-i | H | H | 1 | H | H | O | CF ₃ | Me |
| Me | Pr | H | H | 1 | H | H | O | CF ₃ | Me |
| Me | Pr-c | H | H | 1 | H | H | O | CF ₃ | Me |
| Me | CH ₂ Pr-c | H | H | 1 | H | H | O | CF ₃ | Me |
| (CH ₂) ₃ - | | H | H | 1 | H | H | O | CF ₃ | Me |
| (CH ₂) ₃ - | | H | H | 1 | H | H | O | CF ₃ | Me |
| (CH ₂) ₃ - | | H | H | 1 | H | H | O | CF ₃ | Me |
| (CH ₂) ₃ - | | H | H | 1 | H | H | O | CF ₃ | Me |
| H | -(CH ₂) ₃ - | H | H | 1 | H | H | O | CF ₃ | Me |
| H | -(CH ₂) ₃ - | H | H | 1 | H | H | O | CF ₃ | Me |
| H | -(CH ₂) ₃ - | H | H | 1 | H | H | O | CF ₃ | Me |
| H | -(CH ₂) ₃ - | H | H | 1 | H | H | O | CF ₃ | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | Me | F |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | Me | OMe |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | Me | OEt |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | Me | OPr-i |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | Me | OPh |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | Me | OCHF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | OCHF ₃ | F |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | OCHF ₃ | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | OCHF ₃ | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | OCHF ₃ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | OCHF ₃ | CN |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | CF ₃ | F |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | CF ₃ | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | CF ₃ | OMe |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | CF ₃ | OEt |

[0108]

[表67]

(77)

特開2002-308857

151

152

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | Z ⁷ | R ²¹ | R ²² |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|----------------|-----------------|---------------------------------------|
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | CF ₃ | OPh |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | CF ₃ | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | CF ₃ | SM _e |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | CF ₃ | SO ₂ Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | CF ₃ | SEt |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | CF ₃ | SO ₂ Et |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | CF ₃ | SPr-i |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | CF ₃ | SO ₂ Pr-i |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | CF ₃ | SPh |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | CF ₃ | SO ₂ Ph |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | CF ₃ | SCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | CF ₃ | SO ₂ CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | CF ₃ | SCF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | CF ₃ | SO ₂ CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | CF ₃ | NH ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | CF ₃ | NHC(=O)Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | CF ₃ | NHC(=O)Ph |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | CF ₃ | NHC(=O)CH ₂ Ph |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | CF ₃ | NHC(=O)CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | CF ₃ | NHSO ₂ Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | CF ₃ | NHSO ₂ Ph |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | CF ₃ | NHSO ₂ CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | CF ₃ | NHSO ₂ CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | CF ₃ | NHMe |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | CF ₃ | NHPh |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | CF ₃ | N(Me)C(=O)Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | CF ₃ | N(Me)C(=O)Ph |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | CF ₃ | N(Me)C(=O)CH ₂ Ph |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | CF ₃ | N(Me)C(=O)CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | CF ₃ | N(Me)SO ₂ Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | CF ₃ | N(Me)SO ₂ Ph |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | CF ₃ | N(Me)SO ₂ CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | CF ₃ | N(Me)SO ₂ CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | CF ₃ | N(Me) ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | CF ₃ | N(Me)Ph |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | CF ₃ | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | CF ₃ | CN |
| H | H | H | H | 1 | H | H | S | CF ₃ | Cl |
| Me | H | H | H | 1 | H | H | S | CF ₃ | Cl |
| Me | H | Me | H | 1 | H | H | S | CF ₃ | Cl |
| Me | Me | Me | H | 1 | H | H | S | CF ₃ | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | Me | H | S | CF ₃ | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | Et | H | S | CF ₃ | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | Pr-i | H | S | CF ₃ | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | Me | Me | S | CF ₃ | Cl |

[0109]

40 【表68】

(78)

特開2002-308857

153

154

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | Z ³ | R ¹¹ | R ¹² |
|-----------------------------------|------------------------------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|----------------|-------------------|----------------------|
| Me | Et | H | H | 1 | H | H | S | CF ₃ | Cl |
| Et | Et | H | H | 1 | H | H | S | CF ₃ | Cl |
| Me | Pr-i | H | H | 1 | H | H | S | CF ₃ | Cl |
| Me | Pr | H | H | 1 | H | H | S | CF ₃ | Cl |
| Me | Pr-c | H | H | 1 | H | H | S | CF ₃ | Cl |
| Me | CH ₂ Pr-c | H | H | 1 | H | H | S | CF ₃ | Cl |
| (CH ₂) ₂ - | | H | H | 1 | H | H | S | CF ₃ | Cl |
| (CH ₂) ₃ - | | H | H | 1 | H | H | S | CF ₃ | Cl |
| (CH ₂) ₄ - | | H | H | 1 | H | H | S | CF ₃ | Cl |
| (CH ₂) ₆ - | | H | H | 1 | H | H | S | CF ₃ | Cl |
| H | -(CH ₂) ₂ - | H | H | 1 | H | H | S | CF ₃ | Cl |
| H | -(CH ₂) ₄ - | H | H | 1 | H | H | S | CF ₃ | Cl |
| H | -(CH ₂) ₅ - | H | H | 1 | H | H | S | CF ₃ | Cl |
| H | -(CH ₂) ₆ - | H | H | 1 | H | H | S | CF ₃ | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | Me | F |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | Me | OMe |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | Me | OEt |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | Me | OPr-i |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | Me | OPh |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | Me | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | Me | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | Me | CN |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | OCHF ₂ | F |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | OCHF ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | OCHF ₂ | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | OCHF ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | OCHF ₂ | CN |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | CF ₃ | F |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | CF ₃ | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | CF ₃ | OMe |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | CF ₃ | OEt |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | CF ₃ | OPr-i |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | CF ₃ | OPh |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | CF ₃ | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | CF ₃ | SMe |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | CF ₃ | SO ₂ Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | CF ₃ | SEt |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | CF ₃ | SO ₂ Et |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | CF ₃ | SPr-i |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | CF ₃ | SO ₂ Pr-i |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | CF ₃ | SPh |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | CF ₃ | SO ₂ Ph |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | CF ₃ | SCHF ₂ |

[0110]

[表69]

(79)

特開2002-308857

155

156

| R ³ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | Z ² | R ³¹ | R ³² |
|---------------------------------|----------------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|----------------|-----------------|---------------------------------------|
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | CF ₃ | SO ₂ CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | CF ₃ | SCF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | CF ₃ | SO ₂ CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | CF ₃ | NH ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | CF ₃ | NHC(=O)Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | CF ₃ | NHC(=O)Ph |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | CF ₃ | NHC(=O)CH ₂ Ph |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | CF ₃ | NHC(=O)CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | CF ₃ | NHSO ₂ Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | CF ₃ | NHSO ₂ Ph |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | CF ₃ | NHSO ₂ CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | CF ₃ | NHSO ₂ CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | CF ₃ | NHMe |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | CF ₃ | NHPh |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | CF ₃ | N(Me)C(=O)Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | CF ₃ | N(Me)C(=O)Ph |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | CF ₃ | N(Me)C(=O)CH ₂ Ph |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | CF ₃ | N(Me)C(=O)CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | CF ₃ | N(Me)SO ₂ Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | CF ₃ | N(Me)SO ₂ Ph |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | CF ₃ | N(Me)SO ₂ CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | CF ₃ | N(Me)SO ₂ CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | CF ₃ | N(Me) ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | CF ₃ | N(Me)Ph |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | CF ₃ | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | CF ₃ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | CF ₃ | CN |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | Ph | Me |
| Me | H | H | H | 0 | H | H | O | CF ₃ | Me |
| Me | H | H | H | 0 | H | H | O | CF ₃ | Me |
| Me | H | Me | H | 0 | H | H | O | CF ₃ | Me |
| Me | Me | Me | H | 0 | H | H | O | CF ₃ | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | Me | H | O | CF ₃ | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | Et | H | O | CF ₃ | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | Pr-i | H | O | CF ₃ | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | Me | Me | O | CF ₃ | Me |
| Me | Et | H | H | 0 | H | H | O | CF ₃ | Me |
| Et | Et | H | H | 0 | H | H | O | CF ₃ | Me |
| Me | Pr-i | H | H | 0 | H | H | O | CF ₃ | Me |
| Me | Pr | H | H | 0 | H | H | O | CF ₃ | Me |
| Me | Pr-c | H | H | 0 | H | H | O | CF ₃ | Me |
| Me | CH ₂ Pr-c | H | H | 0 | H | H | O | CF ₃ | Me |
| (CH ₂) _r | | H | H | 0 | H | H | O | CF ₃ | Me |
| (CH ₂) _r | | H | H | 0 | H | H | O | CF ₃ | Me |
| (CH ₂) _r | | H | H | 0 | H | H | O | CF ₃ | Me |

【0111】

【表70】

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | Z ⁷ | R ⁸¹ | R ⁸² |
|---------------------------------|------------------------------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|----------------|-------------------|------------------------------------|
| (CH ₂) ₅ | | H | H | 0 | H | H | O | CF ₃ | Me |
| H | -(CH ₂) ₃ - | H | H | 0 | H | H | O | CF ₃ | Me |
| H | -(CH ₂) ₄ - | H | H | 0 | H | H | O | CF ₃ | Me |
| H | -(CH ₂) ₅ - | H | H | 0 | H | H | O | CF ₃ | Me |
| H | -(CH ₂) ₆ - | H | H | 0 | H | H | O | CF ₃ | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | Me | F |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | Me | OMe |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | Me | OEt |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | Me | OPr-i |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | Me | OPh |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | Me | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | OCHF ₂ | F |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | OCHF ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | OCHF ₂ | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | OCHF ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | OCHF ₂ | CN |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | CF ₃ | F |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | CF ₃ | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | CF ₃ | OMe |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | CF ₃ | OEt |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | CF ₃ | OPh |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | CF ₃ | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | CF ₃ | SMc |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | CF ₃ | SO ₂ Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | CF ₃ | SEt |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | CF ₃ | SO ₂ Et |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | CF ₃ | SPr-i |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | CF ₃ | SO ₂ Pr-i |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | CF ₃ | SPh |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | CF ₃ | SO ₂ Ph |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | CF ₃ | SCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | CF ₃ | SO ₂ CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | CF ₃ | SCF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | CF ₃ | SO ₂ CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | CF ₃ | NH ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | CF ₃ | NHC(=O)Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | CF ₃ | NHC(=O)Ph |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | CF ₃ | NHC(=O)CH ₂ Ph |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | CF ₃ | NHC(=O)CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | CF ₃ | NHSO ₂ Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | CF ₃ | NHSO ₂ Ph |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | CF ₃ | NHSO ₂ CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | CF ₃ | NHSO ₂ CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | CF ₃ | NHMe |

【0112】

【表71】

(81)

特開2002-308857

159

160

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | Z | R ⁷ | R ⁸ |
|---------------------------------|---------------------------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|---|-----------------|---------------------------------------|
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | CF ₃ | NHPh |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | CF ₃ | N(Me)C(=O)Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | CF ₃ | N(Me)C(=O)Ph |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | CF ₃ | N(Me)C(=O)CH ₂ Ph |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | CF ₃ | N(Me)C(=O)CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | CF ₃ | N(Me)SO ₂ Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | CF ₃ | N(Me)SO ₂ Ph |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | CF ₃ | N(Me)SO ₂ CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | CF ₃ | N(Me)SO ₂ CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | CF ₃ | N(Me) ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | CF ₃ | N(Me)Ph |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | CF ₃ | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | CF ₃ | CN |
| H | H | H | H | 0 | H | H | S | CF ₃ | Cl |
| Me | H | H | H | 0 | H | H | S | CF ₃ | Cl |
| Me | H | Me | H | 0 | H | H | S | CF ₃ | Cl |
| Me | Me | Me | H | 0 | H | H | S | CF ₃ | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | Me | H | S | CF ₃ | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | Et | H | S | CF ₃ | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | Pr-i | H | S | CF ₃ | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | Me | Me | S | CF ₃ | Cl |
| Me | Et | H | H | 0 | H | H | S | CF ₃ | Cl |
| Et | Et | H | H | 0 | H | H | S | CF ₃ | Cl |
| Me | Pr-i | H | H | 0 | H | H | S | CF ₃ | Cl |
| Me | Pr | H | H | 0 | H | H | S | CF ₃ | Cl |
| Me | Pr-c | H | H | 0 | H | H | S | CF ₃ | Cl |
| Me | CH ₂ Pr-c | H | H | 0 | H | H | S | CF ₃ | Cl |
| (CH ₂) ₇ | | H | H | 0 | H | H | S | CF ₃ | Cl |
| (CH ₂) ₇ | | H | H | 0 | H | H | S | CF ₃ | Cl |
| (CH ₂) ₇ | | H | H | 0 | H | H | S | CF ₃ | Cl |
| (CH ₂) ₇ | | H | H | 0 | H | H | S | CF ₃ | Cl |
| H | (CH ₂) ₇ | | H | 0 | H | H | S | CF ₃ | Cl |
| H | (CH ₂) ₇ | | H | 0 | H | H | S | CF ₃ | Cl |
| H | (CH ₂) ₇ | | H | 0 | H | H | S | CF ₃ | Cl |
| H | (CH ₂) ₇ | | H | 0 | H | H | S | CF ₃ | Cl |

【0113】

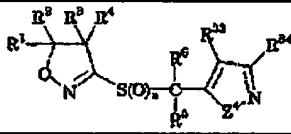
【表72】

(82)

特開2002-308857

161

162

|  | | | | | | | | | |
|---|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|----------------|------------------------------------|-----------------|
| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | Z ¹ | R ³⁹ | R ³⁴ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NMe | Cl | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NMe | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NMe | Cl | Et |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NMe | Cl | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NMe | CF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NMe | CF ₃ | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NMe | OCHF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NMe | OCHF ₃ | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NMe | C(=O)Me | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NMe | C(=O)Me | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NMe | -(CH ₂) ₃ - | |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NMe | -(CH ₂) ₄ - | |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NEt | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NEt | CF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NEt | CF ₃ | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NEt | OCHF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NEt | OCHF ₃ | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NEt | -(CH ₂) ₃ - | |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NEt | -(CH ₂) ₄ - | |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NPr-i | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NPr-i | CF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NPr-i | CF ₃ | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NPr-i | OCHF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NPr-i | OCHF ₃ | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NPr-i | -(CH ₂) ₃ - | |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NPr-i | -(CH ₂) ₄ - | |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NPr | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NPr | CF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NPr | CF ₃ | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NPr | OCHF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NPr | OCHF ₃ | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NPr | -(CH ₂) ₃ - | |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NPr | -(CH ₂) ₄ - | |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NBu-t | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NBu-t | CF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NBu-t | CF ₃ | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NBu-t | OCHF ₃ | H |

[0114]

40 [表73]

(83)

特開2002-308857

163

164

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | Z ¹ | R ²⁰ | R ²¹ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|-------------------------------------|--|-----------------|
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NBu-t | OCHF ₂ | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NBu-t | -(CH ₂) ₃ -(CH ₂) ₄ | |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NBu-t | | |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NCH ₂ Ph | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NCH ₂ Ph | CF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NCH ₂ Ph | OCHF ₂ | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NCH ₂ OMe | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NCH ₂ OMe | CF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NCH ₂ OMe | OCHF ₂ | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NCH ₂ C≡CH | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NCH ₂ C≡CH | CF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NCH ₂ C≡CH | OCHF ₂ | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NCH ₂ CH=CH ₂ | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NCH ₂ CH=CH ₂ | CF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NCH ₂ CH=CH ₂ | OCHF ₂ | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NCHF ₂ | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NCHF ₂ | CF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NCHF ₂ | CF ₃ | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NCHF ₂ | OCHF ₂ | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NCHF ₂ | OCHF ₂ | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NCHF ₂ | C(=O)Me | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NCHF ₂ | C(=O)Me | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NCHF ₂ | -(CH ₂) ₃ -(CH ₂) ₄ | |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NCHF ₂ | | |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NPh | OMe | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NPh | OEt | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NPh | OCHF ₂ | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NPh | OCH ₂ CF ₃ | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NPh | CF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NPh | OCH ₂ CH=CH ₂ | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NPh | OCH ₂ C≡CH | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NPh | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | N(2-Cl)Ph | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | N(2-F)Ph | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | N(2-OMe)Ph | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | N(2-Me)Ph | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | N(3-Cl)Ph | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | N(3-F)Ph | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | N(3-OMe)Ph | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | N(3-Me)Ph | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | N(4-Cl)Ph | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | N(4-F)Ph | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | N(4-OMe)Ph | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | N(4-Me)Ph | Cl | Me |

[0115]

【表74】

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | Z ¹ | R ²³ | R ²⁴ |
|---------------------------------|----------------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|---------------------------|-------------------|-----------------|
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | N(Thiophen-2-yl) | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | N(Thiophen-2-yl) | CF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | N(Thiophen-2-yl) | OCHF ₂ | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NC(=O)Me | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NC(=O)Me | CF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NC(=O)Me | OCHF ₂ | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NC(=O)CF ₃ | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NC(=O)CF ₃ | CF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NC(=O)CF ₃ | OCHF ₂ | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NC(=O)CH ₂ Ph | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NC(=O)CH ₂ Ph | CF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NC(=O)CH ₂ Ph | OCHF ₂ | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NC(=O)Ph | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NC(=O)Ph | CF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NC(=O)Ph | OCHF ₂ | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NC(=O)OMe | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NC(=O)OMe | CF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NC(=O)OMe | OCHF ₂ | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NC(=O)OCH ₂ Ph | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NC(=O)OCH ₂ Ph | CF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NC(=O)OCH ₂ Ph | OCHF ₂ | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NC(=O)OPh | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NC(=O)OPh | CF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NC(=O)OPh | OCHF ₂ | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NC(=O)NHMe | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NC(=O)NHMe | CF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NC(=O)NHMe | OCHF ₂ | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NC(=O)N(Me) ₂ | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NC(=O)N(Me) ₂ | CF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NC(=O)N(Me) ₂ | OCHF ₂ | H |
| H | H | H | H | 2 | H | H | NPh | Cl | Me |
| Me | H | H | H | 2 | H | H | NPh | Cl | Me |
| Me | H | Me | H | 2 | H | H | NPh | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | Me | H | NPh | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | Et | H | NPh | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | Pr-i | H | NPh | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | Me | Me | NPh | Cl | Me |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | NPh | Cl | Me |
| Et | Et | H | H | 2 | H | H | NPh | Cl | Me |
| Me | Pr-i | H | H | 2 | H | H | NPh | Cl | Me |
| Me | Pr | H | H | 2 | H | H | NPh | Cl | Me |
| Me | Pr-c | H | H | 2 | H | H | NPh | Cl | Me |
| Me | CH ₂ Pr-c | H | H | 2 | H | H | NPh | Cl | Me |
| (CH ₂) ₈ | | H | H | 2 | H | H | NPh | Cl | Me |
| (CH ₂) ₈ | | H | H | 2 | H | H | NPh | Cl | Me |

[0116]

[表75]

(85)

特開2002-308857

167

168

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | Z ¹ | R ²³ | R ²⁴ |
|----------------|------------------------------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|----------------|------------------------------------|-----------------|
| | -(CH ₂) ₄ - | H | H | 2 | H | H | NPh | Cl | Me |
| | -(CH ₂) ₅ - | H | H | 2 | H | H | NPh | Cl | Me |
| H | -(CH ₂) ₃ - | H | H | 2 | H | H | NPh | Cl | Me |
| H | -(CH ₂) ₄ - | H | H | 2 | H | H | NPh | Cl | Me |
| H | -(CH ₂) ₅ - | H | H | 2 | H | H | NPh | Cl | Me |
| H | -(CH ₂) ₆ - | H | H | 2 | H | H | NPh | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | H | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | H | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NMe | Cl | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NMe | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NMe | Cl | Et |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NMe | Cl | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NMe | CF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NMe | CF ₃ | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NMe | OCHF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NMe | OCHF ₃ | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NMe | C(=O)Me | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NMe | C(=O)Me | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NMe | -(CH ₂) ₃ - | |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NMe | -(CH ₂) ₄ - | |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NEt | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NEt | CF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NEt | CF ₃ | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NEt | OCHF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NEt | OCHF ₃ | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NEt | -(CH ₂) ₃ - | |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NEt | -(CH ₂) ₄ - | |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NPr-i | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NPr-i | CF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NPr-i | CF ₃ | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NPr-i | OCHF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NPr-i | OCHF ₃ | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NPr-i | -(CH ₂) ₃ - | |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NPr-i | -(CH ₂) ₄ - | |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NPr | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NPr | CF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NPr | CF ₃ | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NPr | OCHF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NPr | OCHF ₃ | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NPr | -(CH ₂) ₃ - | |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NPr | -(CH ₂) ₄ - | |

【0117】

【表76】

(86)

特開2002-308857

169

170

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | Z ¹ | R ²³ | R ²⁴ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|-------------------------------------|--|-----------------|
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NBu-t | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NBu-t | CF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NBu-t | CF ₃ | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NBu-t | OCHF ₂ | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NBu-t | OCHF ₃ | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NBu-t | -(CH ₂) ₃ - -(CH ₂) ₄ - | |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NBu-t | | |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NCH ₂ Ph | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NCH ₂ Ph | CF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NCH ₂ Ph | OCHF ₂ | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NCH ₂ OMe | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NCH ₂ OMe | CF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NCH ₂ OMe | OCHF ₂ | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NCH ₂ C≡CH | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NCH ₂ C≡CH | CF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NCH ₂ C≡CH | OCHF ₂ | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NCH ₂ CH=CH ₂ | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NCH ₂ CH=CH ₂ | CF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NCH ₂ CH=CH ₂ | OCHF ₂ | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NCHF ₂ | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NCHF ₂ | CF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NCHF ₂ | CF ₃ | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NCHF ₂ | OCHF ₂ | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NCHF ₂ | OCHF ₂ | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NCHF ₂ | C(=O)Me | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NCHF ₂ | C(=O)Me | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NCHF ₂ | -(CH ₂) ₃ - -(CH ₂) ₄ - | |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NCHF ₂ | | |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NPh | OMe | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NPh | OBt | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NPh | OCHF ₂ | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NPh | OCH ₂ CF ₃ | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NPh | CF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NPh | OCH ₂ CH=CH ₂ | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NPh | OCH ₂ C≡CH | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NPh | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | N(2-Cl)Ph | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | N(2-F)Ph | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | N(2-OMe)Ph | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | N(2-Me)Ph | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | N(3-Cl)Ph | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | N(3-F)Ph | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | N(3-OMe)Ph | Cl | Me |

[0118]

[表77]

(87)

特開2002-308857

171

172

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | Z ¹ | R ³² | R ³⁴ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|---------------------------|-------------------|-----------------|
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | N(3-Me)Ph | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | N(4-Cl)Ph | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | N(4-F)Ph | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | N(4-OMe)Ph | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | N(4-Me)Ph | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | N(Thiophen-2-yl) | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | N(Thiophen-2-yl) | CF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | N(Thiophen-2-yl) | OCHF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NC(=O)Me | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NC(=O)Me | CF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NC(=O)Me | OCHF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NC(=O)CF ₃ | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NC(=O)CF ₃ | CF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NC(=O)CF ₃ | OCHF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NC(=O)CH ₂ Ph | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NC(=O)CH ₂ Ph | CF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NC(=O)CH ₂ Ph | OCHF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NC(=O)Ph | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NC(=O)Ph | CF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NC(=O)Ph | OCHF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NC(=O)OMe | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NC(=O)OMe | CF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NC(=O)OMe | OCHF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NC(=O)OCH ₂ Ph | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NC(=O)OCH ₂ Ph | CF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NC(=O)OCH ₂ Ph | OCHF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NC(=O)OPh | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NC(=O)OPh | CF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NC(=O)OPh | OCHF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NC(=O)NHMe | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NC(=O)NHMe | CF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NC(=O)NHMe | OCHF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NC(=O)N(Me) ₂ | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NC(=O)N(Me) ₂ | CF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NC(=O)N(Me) ₂ | OCHF ₃ | H |
| H | H | H | H | 1 | H | H | NPh | Cl | Me |
| Me | H | H | H | 1 | H | H | NPh | Cl | Me |
| Me | H | Me | H | 1 | H | H | NPh | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | Me | H | NPh | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | Et | H | NPh | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | Pr-i | H | NPh | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | Me | Me | NPh | Cl | Me |
| Me | Et | H | H | 1 | H | H | NPh | Cl | Me |
| Et | Et | H | H | 1 | H | H | NPh | Cl | Me |
| Me | Pr-i | H | H | 1 | H | H | NPh | Cl | Me |

【0119】

【表78】

(88)

特開2002-308857

173

174

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | Z ⁴ | R ²³ | R ²⁴ |
|----------------|------------------------------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|----------------|------------------------------------|-----------------|
| Me | Pr | H | H | 1 | H | H | NPh | Cl | Me |
| Me | Pr-c | H | H | 1 | H | H | NPh | Cl | Me |
| Me | CH ₃ Pr-c | H | H | 1 | H | H | NPh | Cl | Me |
| | -(CH ₂) ₂ - | H | H | 1 | H | H | NPh | Cl | Me |
| | -(CH ₂) ₃ - | H | H | 1 | H | H | NPh | Cl | Me |
| | -(CH ₂) ₄ - | H | H | 1 | H | H | NPh | Cl | Me |
| | -(CH ₂) ₅ - | H | H | 1 | H | H | NPh | Cl | Me |
| H | -(CH ₂) ₂ - | H | H | 1 | H | H | NPh | Cl | Me |
| H | -(CH ₂) ₄ - | H | H | 1 | H | H | NPh | Cl | Me |
| H | -(CH ₂) ₆ - | H | H | 1 | H | H | NPh | Cl | Me |
| H | -(CH ₂) ₈ - | H | H | 1 | H | H | NPh | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | H | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | H | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NMe | Cl | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NMe | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NMe | Cl | Et |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NMe | Cl | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NMe | CF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NMe | CF ₃ | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NMe | OCHF ₂ | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NMe | OCHF ₂ | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NMe | C(=O)Me | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NMe | C(=O)Me | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NMe | -(CH ₂) ₃ - | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NMe | -(CH ₂) ₄ - | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NEt | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NEt | CF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NEt | CF ₃ | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NEt | OCHF ₂ | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NEt | OCHF ₂ | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NEt | -(CH ₂) ₃ - | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NEt | -(CH ₂) ₄ - | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NPr-i | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NPr-i | CF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NPr-i | CF ₃ | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NPr-i | OCHF ₂ | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NPr-i | OCHF ₂ | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NPr-i | -(CH ₂) ₃ - | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NPr-i | -(CH ₂) ₄ - | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NPr | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NPr | CF ₃ | H |

【0120】

【表79】

(89)

特開2002-308857

175

176

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ^b | R ^c | Z ^d | R ^{2b} | R ^{2d} |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|-------------------------------------|-------------------------------------|-----------------|
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NPr | CF ₃ | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NPr | OCHF ₂ | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NPr | OCHF ₂ | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NPr | -(CH ₂) ₃ - | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NPr | -(CH ₂) ₄ - | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NBu-t | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NBu-t | CF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NBu-t | CF ₃ | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NBu-t | OCHF ₂ | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NBu-t | OCHF ₂ | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NBu-t | -(CH ₂) ₃ - | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NBu-t | -(CH ₂) ₄ - | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NCH ₂ Ph | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NCH ₂ Ph | CF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NCH ₂ Ph | OCHF ₂ | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NCH ₂ OMe | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NCH ₂ OMe | CF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NCH ₂ OMe | OCHF ₂ | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NCH ₂ C≡CH | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NCH ₂ C≡CH | CF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NCH ₂ C≡CH | OCHF ₂ | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NCH ₂ CH=CH ₂ | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NCH ₂ CH=CH ₂ | CF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NCH ₂ CH=CH ₂ | OCHF ₂ | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NCHF ₂ | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NCHF ₂ | CF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NCHF ₂ | CF ₃ | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NCHF ₂ | OCHF ₂ | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NCHF ₂ | OCHF ₂ | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NCHF ₂ | C(=O)Me | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NCHF ₂ | C(=O)Me | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NCHF ₂ | -(CH ₂) ₃ - | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NCHF ₂ | -(CH ₂) ₄ - | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NPh | OMe | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NPh | OEt | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NPh | OCHF ₂ | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NPh | OCH ₂ CF ₃ | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NPh | CF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NPh | OCH ₂ CH=CH ₂ | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NPh | OCH ₂ C≡CH | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NPh | Cl | Me |

[0121]

【表80】

(90)

特開2002-308857

177

178

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | a | R ⁵ | R ⁶ | Z ¹ | R ³² | R ³⁴ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|---------------------------|-------------------|-----------------|
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | N(2-Cl)Ph | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | N(2-F)Ph | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | N(2-OMe)Ph | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | N(2-Me)Ph | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | N(3-Cl)Ph | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | N(3-F)Ph | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | N(3-OMe)Ph | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | N(3-Me)Ph | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | N(4-Cl)Ph | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | N(4-F)Ph | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | N(4-OMe)Ph | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | N(4-Me)Ph | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | N(Thiophen-2-yl) | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | N(Thiophen-2-yl) | CF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | N(Thiophen-2-yl) | OCHF ₂ | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NC(=O)Me | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NC(=O)Me | CF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NC(=O)Me | OCHF ₂ | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NC(=O)CF ₃ | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NC(=O)CF ₃ | CF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NC(=O)CF ₃ | OCHF ₂ | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NC(=O)CH ₂ Ph | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NC(=O)CH ₂ Ph | CF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NC(=O)CH ₂ Ph | OCHF ₂ | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NC(=O)Ph | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NC(=O)Ph | CF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NC(=O)Ph | OCHF ₂ | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NC(=O)OMe | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NC(=O)OMe | CF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NC(=O)OMe | OCHF ₂ | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NC(=O)OCH ₂ Ph | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NC(=O)OCH ₂ Ph | CF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NC(=O)OCH ₂ Ph | OCHF ₂ | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NC(=O)OPh | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NC(=O)OPh | CF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NC(=O)OPh | OCHF ₂ | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NC(=O)NHMe | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NC(=O)NHMe | CF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NC(=O)NHMe | OCHF ₂ | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NC(=O)N(Me) ₂ | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NC(=O)N(Me) ₂ | CF ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NC(=O)N(Me) ₂ | OCHF ₂ | H |
| H | H | H | H | 0 | H | H | NPh | Cl | Me |
| Me | H | H | H | 0 | H | H | NPh | Cl | Me |
| Me | H | Me | H | 0 | H | H | NPh | Cl | Me |

【0122】

【表81】

(91)

特開2002-308857

179

180

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | Z ¹ | R ^{8a} | R ^{8a} |
|----------------|------------------------------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|----------------|-----------------|-----------------|
| Me | Me | H | H | 0 | Me | H | NPh | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | Et | H | NPh | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | Pr-i | H | NPh | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | Me | Me | NPh | Cl | Me |
| Me | Et | H | H | 0 | H | H | NPh | Cl | Me |
| Et | Et | H | H | 0 | H | H | NPh | Cl | Me |
| Me | Pr-i | H | H | 0 | H | H | NPh | Cl | Me |
| Me | Pr | H | H | 0 | H | H | NPh | Cl | Me |
| Me | Pr-c | H | H | 0 | H | H | NPh | Cl | Me |
| Me | CH ₂ Pr-c | H | H | 0 | H | H | NPh | Cl | Me |
| | -(CH ₂) ₁ - | H | H | 0 | H | H | NPh | Cl | Me |
| | -(CH ₂) ₂ - | H | H | 0 | H | H | NPh | Cl | Me |
| | -(CH ₂) ₃ - | H | H | 0 | H | H | NPh | Cl | Me |
| | -(CH ₂) ₄ - | H | H | 0 | H | H | NPh | Cl | Me |
| | -(CH ₂) ₅ - | H | H | 0 | H | H | NPh | Cl | Me |
| H | -(CH ₂) ₃ - | H | H | 0 | H | H | NPh | Cl | Me |
| H | -(CH ₂) ₄ - | H | H | 0 | H | H | NPh | Cl | Me |
| H | -(CH ₂) ₅ - | H | H | 0 | H | H | NPh | Cl | Me |
| H | -(CH ₂) ₆ - | H | H | 0 | H | H | NPh | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | H | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | H | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | Cl | Me |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | NH | H | H |

【0123】

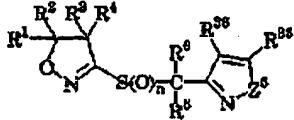
【表82】

(92)

特開2002-308857

181

182

|  | | | | | | | | | |
|---|------------------------------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|-------------------------------------|-----------------|----------------------------------|
| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | Z ⁵ | R ¹⁵ | R ¹⁶ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NMe | H | OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NMe | H | OBt |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NMe | H | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NMe | H | OCH ₂ CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NMe | | -(CH ₂) ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NMe | | -(CH ₂) ₄ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NEt | | -(CH ₂) ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NEt | | -(CH ₂) ₄ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NPr-i | | -(CH ₂) ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NPr-i | | -(CH ₂) ₄ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NCHF ₂ | | -(CH ₂) ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NCHF ₂ | | -(CH ₂) ₄ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | N(CH ₂) ₃ O- | | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | N(CH ₂) ₄ O- | | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | N(CH ₂) ₄ - | | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | N(CH ₂) ₅ - | | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NPh | H | OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NPh | H | OBt |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NPh | H | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | NPh | H | OCH ₂ CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | Me | H |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | Me | H |
| H | H | H | H | 2 | H | H | NPh | H | OMe |
| Me | H | H | H | 2 | H | H | NPh | H | OBt |
| Me | H | Me | H | 2 | H | H | NPh | H | OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | Me | H | NPh | H | OBt |
| Me | Me | H | H | 2 | Et | H | NPh | H | OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | Pr-i | H | NPh | H | OBt |
| Me | Me | H | H | 2 | Me | Me | NPh | H | OMe |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | NPh | H | OBt |
| Et | Et | H | H | 2 | H | H | NPh | H | OMe |
| Me | Pr-i | H | H | 2 | H | H | NPh | H | OBt |
| Me | Pr | H | H | 2 | H | H | NPh | H | OMe |
| Me | Pr-c | H | H | 2 | H | H | NPh | H | OBt |
| Me | CH ₂ Pr-c | H | H | 2 | H | H | NPh | H | OMe |
| | -(CH ₂) ₂ - | H | H | 2 | H | H | NPh | H | OBt |
| | -(CH ₂) ₃ - | H | H | 2 | H | H | NPh | H | OMe |
| | -(CH ₂) ₄ - | H | H | 2 | H | H | NPh | H | OBt |
| | -(CH ₂) ₅ - | H | H | 2 | H | H | NPh | H | OMe |
| H | -(CH ₂) ₃ - | H | H | 2 | H | H | NPh | H | OBt |

[0124]

[表83]

(93)

特開2002-308857

183

184

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | Z ⁵ | R ³⁵ | R ³⁶ |
|----------------|----------------------------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|-------------------|-------------------------------------|----------------------------------|
| H | -(CH ₂) _r | H | H | 2 | H | H | NPh | H | OMe |
| H | -(CH ₂) ₅ | H | H | 2 | H | H | NPh | H | OMe |
| H | -(CH ₂) ₆ | H | H | 2 | H | H | NPh | H | OBt |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NMe | H | OMe |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NMe | H | OBt |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NMe | H | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NMe | H | OCH ₂ CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NMe | | -(CH ₂) ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NMe | | -(CH ₂) ₄ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NEt | | -(CH ₂) ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NEt | | -(CH ₂) ₄ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NPr-i | | -(CH ₂) ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NPr-i | | -(CH ₂) ₄ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NCHF ₂ | | -(CH ₂) ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NCHF ₂ | | -(CH ₂) ₄ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | | N(CH ₂) ₃ O- | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | | N(CH ₂) ₄ O- | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | | N(CH ₂) ₅ | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | | N(CH ₂) ₅ | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NPh | H | OMe |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NPh | H | OBt |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NPh | H | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NPh | H | OCH ₂ CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | O | Me | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | S | Me | H |
| H | H | H | H | 1 | H | H | NPh | H | OMe |
| Me | H | H | H | 1 | H | H | NPh | H | OBt |
| Me | H | Me | H | 1 | H | H | NPh | H | OMe |
| Me | Me | H | H | 1 | Me | H | NPh | H | OBt |
| Me | Me | H | H | 1 | Et | H | NPh | H | OMe |
| Me | Me | H | H | 1 | Pr-i | H | NPh | H | OBt |
| Me | Me | H | H | 1 | Me | Me | NPh | H | OMe |
| Me | Et | H | H | 1 | H | H | NPh | H | OBt |
| Et | Et | H | H | 1 | H | H | NPh | H | OMe |
| Me | Pr-i | H | H | 1 | H | H | NPh | H | OBt |
| Me | Pr | H | H | 1 | H | H | NPh | H | OMe |
| Me | Pr-c | H | H | 1 | H | H | NPh | H | OBt |
| Me | CH ₂ Pr-c | H | H | 1 | H | H | NPh | H | OMe |
| | -(CH ₂) _r | H | H | 1 | H | H | NPh | H | OBt |
| | -(CH ₂) ₅ | H | H | 1 | H | H | NPh | H | OMe |
| | -(CH ₂) ₄ | H | H | 1 | H | H | NPh | H | OBt |
| | -(CH ₂) ₅ | H | H | 1 | H | H | NPh | H | OMe |
| H | -(CH ₂) _r | H | H | 1 | H | H | NPh | H | OBt |

[0125]

【表84】

(94)

特開2002-308857

| 185 | | | | | | | | | | 186 | |
|----------------|------------------------------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|-------------------------------------|-----------------|--|-------------------------------------|--|
| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | Z ⁵ | R ³⁵ | | R ³⁶ | |
| H | -(CH ₂) ₄ - | H | H | 1 | H | H | NPh | H | | OMe | |
| H | -(CH ₂) ₅ - | H | H | 1 | H | H | NPh | H | | OMe | |
| H | -(CH ₂) ₆ - | H | H | 1 | H | H | NPh | H | | OEt | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NMe | H | | OMe | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NMe | H | | OEt | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NMe | H | | OCH ₂ F ₂ | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NMe | H | | OCH ₂ CF ₃ | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NMe | | | -(CH ₂) ₄ - | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NMe | | | -(CH ₂) ₅ - | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NEt | | | -(CH ₂) ₆ - | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NEt | | | -(CH ₂) ₇ - | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NPr-i | | | -(CH ₂) ₈ - | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NPr-i | | | -(CH ₂) ₉ - | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NCH ₂ F ₂ | | | -(CH ₂) ₁₀ - | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NCH ₂ F ₂ | | | -(CH ₂) ₁₁ - | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | | | | | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | N(CH ₂) ₄ O- | | | H | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | N(CH ₂) ₅ O- | | | H | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | N(CH ₂) ₆ - | | | H | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | N(CH ₂) ₇ - | | | H | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NPh | H | | OMe | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NPh | H | | OEt | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NPh | H | | OCH ₂ F ₂ | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NPh | H | | OCH ₂ CF ₃ | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | Me | | H | |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | Me | | H | |
| H | H | H | H | 0 | H | H | NPh | H | | OMe | |
| Me | H | H | H | 0 | H | H | NPh | H | | OEt | |
| Me | H | Me | H | 0 | H | H | NPh | H | | OMe | |
| Me | Me | H | H | 0 | Me | H | NPh | H | | OEt | |
| Me | Me | H | H | 0 | Et | H | NPh | H | | OMe | |
| Me | Me | H | H | 0 | Pr-i | H | NPh | H | | OEt | |
| Me | Me | H | H | 0 | Me | Me | NPh | H | | OMe | |
| Me | Et | H | H | 0 | H | H | NPh | H | | OEt | |
| Et | Et | H | H | 0 | H | H | NPh | H | | OMe | |
| Me | Pr-i | H | H | 0 | H | H | NPh | H | | OEt | |
| Me | Pr | H | H | 0 | H | H | NPh | H | | OMe | |
| Me | Pr-c | H | H | 0 | H | H | NPh | H | | OEt | |
| Me | CH ₂ Pr-c | H | H | 0 | H | H | NPh | H | | OMe | |
| | -(CH ₂) ₂ - | H | H | 0 | H | H | NPh | H | | OEt | |
| | -(CH ₂) ₃ - | H | H | 0 | H | H | NPh | H | | OMe | |
| | -(CH ₂) ₄ - | H | H | 0 | H | H | NPh | H | | OEt | |
| | -(CH ₂) ₅ - | H | H | 0 | H | H | NPh | H | | OMe | |
| H | -(CH ₂) ₆ - | H | H | 0 | H | H | NPh | H | | OEt | |

[0126]

40 [表85]

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | Z ⁵ | R ³⁵ | | R ³⁶ | |
|----------------|------------------------------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|----------------|-----------------|--|-----------------|--|
| H | -(CH ₂) ₄ - | H | H | 0 | H | H | NPh | H | | OMe | |
| H | -(CH ₂) ₅ - | H | H | 0 | H | H | NPh | H | | OMe | |
| H | -(CH ₂) ₆ - | H | H | 0 | H | H | NPh | H | | OEt | |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | O | H | | H | |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | S | H | | H | |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | NH | H | | H | |

[0127]

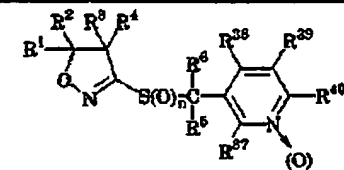
[表86]

(95)

特開2002-308857

187

188

|  | | | | | | | | | | | |
|---|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|-----------------|---------------------------------|---------------------------------|-----------------|---------|
| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ³⁷ | R ³⁸ | R ³⁹ | R ⁴⁰ | |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | H | H | H | - |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | H | H | H | N-oxide |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | Ph | H | H | - |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OMe | Ph | H | H | - |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | Me | H | H | - |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OMe | Me | H | H | - |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | CF ₃ | H | H | - |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | CF ₃ | H | H | N-oxide |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CF ₃ | H | H | - |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | CN | CF ₃ | H | H | - |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OMe | CF ₃ | H | H | - |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OEt | CF ₃ | H | H | - |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | Me | H | H | N-oxide |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Ph | Ph | H | H | - |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | (4-Cl)Ph | H | Me | - |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | (4-Cl)Ph | H | H | - |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OMe | Cl | H | H | - |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | (CH ₂) ₅ | H | H | - |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | (CH ₂) ₃ | H | H | - |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | (CH ₂) ₄ | H | H | - |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | (CH ₂) ₄ | H | H | - |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | H | (CH ₂) ₅ | H | - |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | H | (CH ₂) ₅ | H | - |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | H | (CH ₂) ₄ | H | - |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | H | (CH ₂) ₄ | H | - |
| H | H | H | H | 2 | H | H | H | CF ₃ | H | H | - |
| Me | H | H | H | 2 | H | H | H | CF ₃ | H | H | - |
| Me | H | Me | H | 2 | H | H | H | CF ₃ | H | H | - |
| Me | Me | Me | H | 2 | H | H | H | CF ₃ | H | H | - |
| Me | Me | H | H | 2 | Me | H | H | CF ₃ | H | H | - |
| Me | Me | H | H | 2 | Et | H | H | CF ₃ | H | H | - |
| Me | Me | H | H | 2 | Pr-i | H | H | CF ₃ | H | H | - |
| Me | Me | H | H | 2 | Me | Me | H | CF ₃ | H | H | - |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | H | CF ₃ | H | H | - |
| Et | Et | H | H | 2 | H | H | H | CF ₃ | H | H | - |
| Me | Pr-i | H | H | 2 | H | H | H | CF ₃ | H | H | - |
| Me | Pr | H | H | 2 | H | H | H | CF ₃ | H | H | - |

【0128】

【表87】

(96)

特開2002-308857

189

190

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | R ⁹ | R ¹⁰ |
|----------------|------------------------------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|----------------|---------------------------------|---------------------------------|-----------------|
| Me | Pr-c | H | H | 2 | H | H | H | CF ₃ | H | H |
| Me | CH ₂ Pr-c | H | H | 2 | H | H | H | CF ₃ | H | H |
| | -(CH ₂) ₂ - | H | H | 2 | H | H | H | CF ₃ | H | H |
| | -(CH ₂) ₃ - | H | H | 3 | H | H | H | CF ₃ | H | H |
| | -(CH ₂) ₄ - | H | H | 2 | H | H | H | CF ₃ | H | H |
| | -(CH ₂) ₅ - | H | H | 2 | H | H | H | CF ₃ | H | H |
| H | -(CH ₂) ₃ - | H | H | 2 | H | H | H | CF ₃ | H | H |
| H | -(CH ₂) ₄ - | H | H | 2 | H | H | H | CF ₃ | H | H |
| H | -(CH ₂) ₅ - | H | H | 2 | H | H | H | CF ₃ | H | H |
| H | -(CH ₂) ₆ - | H | H | 2 | H | H | H | CF ₃ | H | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | H | H | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | H | H | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | Ph | H | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OMe | Ph | H | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | Me | H | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OMe | Me | H | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | CF ₃ | H | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | CF ₃ | H | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | CN | CF ₃ | H | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OMe | CF ₃ | H | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OBu | CF ₃ | H | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Me | Me | H | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Ph | Ph | H | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | (4-Cl)Ph | H | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | (4-Cl)Ph | H | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OMe | Cl | H | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | (CH ₂) ₃ | H | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Me | (CH ₂) ₃ | H | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | (CH ₂) ₄ | H | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Me | (CH ₂) ₄ | H | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | H | (CH ₂) ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Me | H | (CH ₂) ₃ | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Cl | H | (CH ₂) ₄ | H |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Me | H | (CH ₂) ₄ | H |
| H | H | H | H | 1 | H | H | H | CF ₃ | H | H |
| Me | H | H | H | 1 | H | H | H | CF ₃ | H | H |
| Me | H | Me | H | 1 | H | H | H | CF ₃ | H | H |
| Me | Me | Me | H | 1 | H | H | H | CF ₃ | H | H |
| Me | Me | H | H | 1 | Me | H | H | CF ₃ | H | H |
| Me | Me | H | H | 1 | Et | H | H | CF ₃ | H | H |
| Me | Me | H | H | 1 | Pr-i | H | H | CF ₃ | H | H |
| Me | Me | H | H | 1 | Me | Me | H | CF ₃ | H | H |

[0129]

【表88】

(97)

特開2002-308857

| 191 | | | | | | 192 | | | | | |
|----------------|------------------------------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|----------------------------------|---------------------------------|---------------------------------|-----------------|---------|
| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ³⁷ | R ³⁸ | R ³⁹ | R ⁴⁰ | |
| Me | Et | H | H | 1 | H | H | H | CF ₃ | H | H | - |
| Et | Et | H | H | 1 | H | H | H | CF ₃ | H | H | - |
| Me | Pr-i | H | H | 1 | H | H | H | CF ₃ | H | H | - |
| Me | Pr | H | H | 1 | H | H | H | CF ₃ | H | H | - |
| Me | Pr-c | H | H | 1 | H | H | H | CF ₃ | H | H | - |
| Me | CH ₂ Pr-c | H | H | 1 | H | H | H | CF ₃ | H | H | - |
| | -(CH ₂) ₂ - | H | H | 1 | H | H | H | CF ₃ | H | H | - |
| | -(CH ₂) ₃ - | H | H | 1 | H | H | H | CF ₃ | H | H | - |
| | -(CH ₂) ₄ - | H | H | 1 | H | H | H | CF ₃ | H | H | - |
| | -(CH ₂) ₅ - | H | H | 1 | H | H | H | OF ₃ | H | H | - |
| H | -(CH ₂) ₅ - | H | H | 1 | H | H | H | CF ₃ | H | H | - |
| H | -(CH ₂) ₆ - | H | H | 1 | H | H | H | CF ₃ | H | H | - |
| H | -(CH ₂) ₆ - | H | H | 1 | H | H | H | CF ₃ | H | H | - |
| H | -(CH ₂) ₆ - | H | H | 1 | H | H | H | CF ₃ | H | H | - |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | H | H | H | - |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | H | H | H | N-oxide |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | Ph | H | H | - |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OMe | Ph | H | H | - |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | Me | H | H | - |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OMe | Me | H | H | - |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | CF ₃ | H | H | - |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | CF ₃ | H | H | - |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | CN | CF ₃ | H | H | - |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OMe | CF ₃ | H | H | - |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OBt | CF ₃ | H | H | - |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Me | Me | H | H | N-oxide |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Ph | Ph | H | H | - |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | (4-Cl)Ph | H | Me | - |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | (4-Cl)Ph | H | H | - |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OMe | Cl | H | H | - |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | (CH ₂) ₃ | H | H | - |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Me | (CH ₂) ₃ | H | H | - |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | (CH ₂) ₄ | H | H | - |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Me | (CH ₂) ₄ | H | H | - |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | H | (CH ₂) ₃ | H | - |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Me | H | (CH ₂) ₃ | H | - |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | H | (CH ₂) ₄ | H | - |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Me | H | (CH ₂) ₄ | H | - |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | (2-Chloropyridin-3-yl)methylthio | H | H | H | - |
| H | H | H | H | 0 | H | H | H | CF ₃ | H | H | - |
| Me | H | H | H | 0 | H | H | H | CF ₃ | H | H | - |

[0130]

[表89]

(98)

特開2002-308857

193

194

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ⁸⁷ | R ⁸⁸ | R ⁸⁹ | R ⁹⁰ | |
|----------------|----------------------------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|-----------------|-----------------|-----------------|-----------------|---|
| Me | Me | Me | H | 0 | H | H | H | CF ₃ | H | H | . |
| Me | H | Me | H | 0 | H | H | H | CF ₃ | H | H | . |
| Me | Me | H | H | 0 | Me | H | H | CF ₃ | H | H | . |
| Me | Me | H | H | 0 | Et | H | H | CF ₃ | H | H | . |
| Me | Me | H | H | 0 | Pr-i | H | H | CF ₃ | H | H | . |
| Me | Me | H | H | 0 | Me | Me | H | CF ₃ | H | H | . |
| Me | Et | H | H | 0 | H | H | H | CF ₃ | H | H | . |
| Et | Et | H | H | 0 | H | H | H | CF ₃ | H | H | . |
| Me | Pr-i | H | H | 0 | H | H | H | CF ₃ | H | H | . |
| Me | Pr | H | H | 0 | H | H | H | CF ₃ | H | H | . |
| Me | Pr-c | H | H | 0 | H | H | H | CF ₃ | H | H | . |
| Me | CH ₂ Pr-c | H | H | 0 | H | H | H | CF ₃ | H | H | . |
| | -(CH ₂) ₂ | H | H | 0 | H | H | H | CF ₃ | H | H | . |
| | -(CH ₂) ₃ | H | H | 0 | H | H | H | CF ₃ | H | H | . |
| | -(CH ₂) ₄ | H | H | 0 | H | H | H | CF ₃ | H | H | . |
| | -(CH ₂) ₅ | H | H | 0 | H | H | H | CF ₃ | H | H | . |
| H | -(CH ₂) ₃ | H | 0 | H | H | H | H | CF ₃ | H | H | . |
| H | -(CH ₂) ₄ | H | 0 | H | H | H | H | CF ₃ | H | H | . |
| H | -(CH ₂) ₅ | H | 0 | H | H | H | H | CF ₃ | H | H | . |
| H | -(CH ₂) ₆ | H | 0 | H | H | H | H | CF ₃ | H | H | . |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | H | H | H | H | . |

【0131】

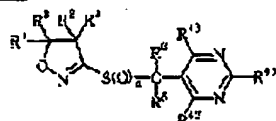
【表90】

(99)

特開2002-308857

195

196



| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ¹¹ | R ¹² | R ¹⁵ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|-----------------|-----------------------------------|-----------------|
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | Cl | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OH | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OMe | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OEt | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OPr ⁱ | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OPr | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OBu ^t | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OCH ₂ Pr ^c | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OCH ₂ Bu ^c | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OCH ₂ Pen ^c | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OCH ₂ Hex ^c | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OPen ^c | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OHex ^c | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OCH ₂ Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OPh | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OCH ₂ F ₃ | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SH | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SMo | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SO ₂ Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SEt | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SO ₂ Et | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SPr ⁱ | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SO ₂ Pr ⁱ | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SPh | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SCl ₂ Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SOCH ₂ F ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SO ₂ CHF ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | NH ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | NHMe | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | NMe ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | NHEt | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | NEt ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | NHPh | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | N(Me)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | CN | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | F | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OH | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OMe | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OEt | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OPr ⁱ | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OPr | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OBu ^t | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OCH ₂ Pr ^c | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OCH ₂ Bu ^c | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OCH ₂ Pen ^c | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OCH ₂ Hex ^c | Me |

[0132]

【表91】

(100)

特開2002-308857

197

198

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | a | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | R ⁹ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|----------------|----------------------------------|----------------|
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OPen-c | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OHen-c | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OCH ₂ Ph | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OPh | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OCHF ₃ | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SH | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SMe | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SO ₂ Me | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SEt | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SO ₂ Et | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SPr-i | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SO ₂ Pr-i | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SPh | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SO ₂ Ph | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SCHF ₃ | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SO ₂ CHF ₃ | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | NH ₂ | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | NHMe | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | NMe ₂ | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | NHEt | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | NEt ₂ | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | NHPh | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | N(Me)Ph | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | CN | Me |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | F | Pri |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | Cl | Pri |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OH | Pri |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OMe | Pri |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OEt | Pri |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OPri | Pri |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OPr | Pri |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OBu-i | Pri |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OCH ₂ Pr-c | Pri |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OCH ₂ Bu-c | Pri |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OCH ₂ Pen-c | Pri |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OCH ₂ Hex-c | Pri |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OPen-c | Pri |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OHen-c | Pri |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OCH ₂ Ph | Pri |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OPh | Pri |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OCHF ₃ | Pri |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SH | Pri |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SMe | Pri |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SO ₂ Me | Pri |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SEt | Pri |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SO ₂ Et | Pri |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SPr-i | Pri |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SO ₂ Pr-i | Pri |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SPh | Pri |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SO ₂ Ph | Pri |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SCHF ₃ | Pri |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SO ₂ CHF ₃ | Pri |

[0133]

【表92】

(101)

特開2002-308857

199

200

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ^{1*} | R ^{2*} |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|----------------|----------------------------------|------------------|
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | NH ₂ | Pr-i |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | NHMe | Pr-i |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | NMe ₂ | Pr-i |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | NHEt | Pr-i |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | NEt ₂ | Pr-i |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | NHPh | Pr-i |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | N(Me)Ph | Pr-i |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | CN | Pr-i |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | F | Pr-e |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | Cl | Pr-e |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OH | Pr-e |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OMe | Pr-e |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OEt | Pr-e |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OPr-i | Pr-e |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OPr | Pr-e |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OBu-t | Pr-e |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OCH ₂ Pr-e | Pr-e |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OCH ₂ Bu-t | Pr-e |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OCH ₂ Pen-e | Pr-e |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OCH ₂ Hex-e | Pr-e |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OPen-e | Pr-e |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OHex-e | Pr-e |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OCH ₂ Ph | Pr-e |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OPh | Pr-e |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OCHF ₃ | Pr-e |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SH | Pr-e |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SMe | Pr-e |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SO ₂ Me | Pr-e |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SEt | Pr-e |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SO ₂ Et | Pr-e |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SPri | Pr-e |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SO ₂ Pr-i | Pr-e |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SPh | Pr-e |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SO ₂ Ph | Pr-e |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SCHF ₃ | Pr-e |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SO ₂ CHF ₃ | Pr-e |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | NH ₂ | Pr-e |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | NHMe | Pr-e |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | NMe ₂ | Pr-e |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | NHEt | Pr-e |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | NEt ₂ | Pr-e |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | NHPh | Pr-e |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | N(Me)Ph | Pr-e |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | CN | Pr-e |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | F | CHF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | Cl | CHF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OH | CHF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OMe | CHF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OEt | CHF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OPr-i | CHF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OPr | CHF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OBu-t | CHF ₃ |

[0134]

[表93]

(102)

特開2002-308857

201

202

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | R ⁹ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|----------------|----------------------------------|------------------|
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OCH ₂ Pro | CHF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OCH ₂ Burc | CHF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OCH ₂ Pen-c | CHF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OCH ₂ Hex-c | CHF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OPen-c | CHF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OHen-c | CHF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OCH ₂ Ph | CHF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OPh | CHF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OCHF ₂ | CHF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SH | CHF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SMe | CHF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SO ₂ Me | CHF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SEt | CHF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SO ₂ Et | CHF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SPri | CHF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SO ₂ Pri | CHF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SPh | CHF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SO ₂ Ph | CHF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SCHF ₂ | CHF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SO ₂ CHF ₂ | CHF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | NH ₂ | CHF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | NHMe | CHF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | NMe ₂ | CHF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | NHEt | CHF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | NEt ₂ | CHF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | NHPh | CHF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | N(Me)Ph | CHF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | CN | CHF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | F | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | Cl | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OH | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OEt | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OPri | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OPr | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OBu-t | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OCH ₂ Pro | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OCH ₂ Burc | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OCH ₂ Pen-c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OCH ₂ Hex-c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OPen-c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OHen-c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OCH ₂ Ph | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OPh | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OCHF ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SH | CF ₃ |

【0135】

【表94】

(103)

特開2002-308857

203

204

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | R ⁹ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|----------------|-----------------------------------|-----------------|
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SO ₂ Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SEt | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SO ₂ Et | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SPri | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SO ₂ Pri | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SPh | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SO ₂ Ph | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SCHF ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SO ₂ CHF ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | NH ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | NHMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | NMe ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | NHEt | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | NEt ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | NHPh | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | N(Me)Ph | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | CN | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | F | OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OH | OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OMe | OMe |
| Me | Me | H | H | 3 | H | H | H | OEt | OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OPri | OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OPr | OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OBur | OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OCH ₂ Pr ^c | OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OCH ₂ Bur ^c | OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OCH ₂ Pen ^c | OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OCH ₂ Hex ^c | OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OPen ^c | OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OHex ^c | OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OCH ₂ Ph | OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OPh | OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OCHF ₂ | OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SH | OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SMe | OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SO ₂ Me | OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SEt | OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SO ₂ Et | OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SPri | OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SO ₂ Pri | OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SPh | OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SO ₂ Ph | OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SCHF ₂ | OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SO ₂ CHF ₂ | OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | NH ₂ | OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | NHMe | OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | NMe ₂ | OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | NHEt | OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | NEt ₂ | OMe |

【0136】

【表95】

(104)

特開2002-308857

205

206

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | R ⁹ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|----------------|----------------------------------|-------------------|
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | NHPh | OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | N(Me)Ph | OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | CN | OMe |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | F | OPh |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OH | OPh |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OMe | OPh |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OCt | OPh |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OPr-i | OPh |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OPr | OPh |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OBu-t | OPh |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OCH ₂ Pr-c | OPh |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OCH ₂ Bu-c | OPh |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OCH ₂ Pen-c | OPh |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OCH ₂ Hex-c | OPh |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OPen-c | OPh |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OHex-c | OPh |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OCH ₂ Ph | OPh |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OPh | OPh |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OCHF ₃ | OPh |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SH | OPh |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SMe | OPh |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SO ₂ Me | OPh |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SEt | OPh |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SO ₂ Et | OPh |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SPr-i | OPh |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SO ₂ Pr-i | OPh |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SPh | OPh |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SO ₂ Ph | OPh |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SCHF ₃ | OPh |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SO ₂ CHF ₃ | OPh |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | NH ₂ | OPh |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | NHMe | OPh |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | NMe ₂ | OPh |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | NHEt | OPh |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | NEt ₂ | OPh |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | NHPh | OPh |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | N(Me)Ph | OPh |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | CN | OPh |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | F | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OH | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OMe | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OCt | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OPr-i | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OPr | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OBu-t | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OCH ₂ Pr-c | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OCH ₂ Bu-c | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OCH ₂ Pen-c | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OCH ₂ Hex-c | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OPen-c | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OHex-c | OCHF ₂ |

【0137】

【表96】

(105)

特開2002-308857

207

208

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | R ⁹ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|----------------|------------------------------------|-------------------|
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OCH ₂ Ph | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OPh | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OC(CH ₃) ₂ | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SH | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SM ₂ | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SO ₂ Me | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SEt | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SO ₂ Et | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SPr-i | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SO ₂ Pr-i | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SPh | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SO ₂ Ph | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SCH ₂ Ph | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | SO ₂ CH ₂ Ph | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | NH ₂ | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | NHMe | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | NMe ₂ | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | NHEt | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | NEt ₂ | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | NHPh | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | N(Me)Ph | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | CN | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | F | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | Cl | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | OH | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | OMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | OEt | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | OPr-i | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | OPr | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | OBu-t | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | OCH ₂ Pr-c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | OCH ₂ Bu-c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | OCH ₂ Pen-c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | OCH ₂ Hex-c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | OPen-c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | OHex-c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | OCH ₂ Ph | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | OPh | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | OCHF ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | SH | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | SM ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | SO ₂ Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | SEt | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | SO ₂ Et | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | SPr-i | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | SO ₂ Pr-i | CF ₃ |

【0138】

【表97】

(106)

特開2002-308857

209

210

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | R ⁹ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|----------------|----------------------------------|-----------------|
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | SPh | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | SO ₂ Ph | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | SCHF ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | SO ₂ CHF ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | NH ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | NHMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | NMe ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | NHEt | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | NEt ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | NHPh | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | N(Me)Ph | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | CN | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OMe | F | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OMe | Cl | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OMe | OH | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OMe | OMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OMe | OEt | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OMe | OPr-i | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OMe | OPr | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OMe | OBur | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OMe | OCH ₂ Pr | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OMe | OCH ₂ Bur | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OMe | OCH ₂ Pen | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OMe | OCH ₂ Hex | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OMe | OPen | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OMe | OHex | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OMe | OCH ₂ Ph | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OMe | OPh | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OMe | OCHF ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OMe | SH | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OMe | SMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OMe | SO ₂ Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OMe | SEt | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OMe | SO ₂ Et | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OMe | SPri | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OMe | SO ₂ Pri | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OMe | SPh | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OMe | SO ₂ Ph | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OMe | SCHF ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OMe | SO ₂ CHF ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OMe | NH ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OMe | NHMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OMe | NMe ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OMe | NHEt | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OMe | NEt ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | OMe | NHPh | CF ₃ |

[0139]

[表98]

(110)

特開2002-308857

217

218

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | R ⁹ |
|---------------------------------|---------------------------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|----------------|-----------------------------------|-----------------|
| (CH ₂) ₂ | H | H | H | 2 | H | H | H | OEt | CF ₃ |
| (CH ₂) ₃ | H | H | H | 2 | H | H | H | OMe | CF ₃ |
| (CH ₂) ₃ | H | H | H | 2 | H | H | H | OEt | CF ₃ |
| (CH ₂) ₄ | H | H | H | 2 | H | H | H | OMe | CF ₃ |
| (CH ₂) ₄ | H | H | H | 2 | H | H | H | OEt | CF ₃ |
| (CH ₂) ₅ | H | H | H | 2 | H | H | H | OMe | CF ₃ |
| (CH ₂) ₅ | H | H | H | 2 | H | H | H | OEt | CF ₃ |
| H | (CH ₂) ₂ | H | H | 2 | H | H | H | OMe | CF ₃ |
| H | (CH ₂) ₃ | H | H | 2 | H | H | H | OEt | CF ₃ |
| H | (CH ₂) ₄ | H | H | 2 | H | H | H | OMe | CF ₃ |
| H | (CH ₂) ₄ | H | H | 2 | H | H | H | OEt | CF ₃ |
| H | (CH ₂) ₅ | H | H | 2 | H | H | H | OMe | CF ₃ |
| H | (CH ₂) ₅ | H | H | 2 | H | H | H | OEt | CF ₃ |
| H | (CH ₂) ₆ | H | H | 2 | H | H | H | OMe | CF ₃ |
| H | (CH ₂) ₆ | H | H | 2 | H | H | H | OEt | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | Cl | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OH | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OMe | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OBt | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OPri | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OPr | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OBu ^t | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCH ₂ Pr ^c | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCH ₂ Bu ^c | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCH ₂ Pen ^c | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCH ₂ Hex ^c | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OPen ^c | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OHex ^c | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCH ₂ Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OPh | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCHF ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SH | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SMe | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SO ₂ Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SEt | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SO ₂ Et | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SPri | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SO ₂ Pri | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SPh | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SO ₂ Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SCHF ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SO ₂ CHF ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NH ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NHMe | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NMe ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NHEt | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NEt ₃ | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NHPh | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | N(Me)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | CN | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | F | Me |

[0143]

[表102]

(111)

特開2002-308857

219

220

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | R ⁹ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|----------------|-----------------------------------|----------------|
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OH | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OMe | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OEt | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OPri | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OPr | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OBu _t | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCH ₂ Pr ^c | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCH ₂ Bu ^c | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCH ₂ Pen ^c | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCH ₂ Hex ^c | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OPen ^c | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OHex ^c | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCH ₂ Ph | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OPh | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCHF ₂ | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SH | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SMc | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SO ₂ Me | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SEt | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SO ₂ Et | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SPri | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SO ₂ Pri | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SPh | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SO ₂ Ph | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SCHF ₂ | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SO ₂ CHF ₂ | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NH ₂ | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NHMe | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NMe ₂ | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NHEt | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NEt ₂ | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NHPh | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | N(Me)Ph | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | CN | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | F | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | Cl | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OH | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OMe | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OEt | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OPri | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OPr | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OBu _t | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCH ₂ Pr ^c | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCH ₂ Bu ^c | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCH ₂ Pen ^c | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCH ₂ Hex ^c | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OPen ^c | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OHex ^c | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCH ₂ Ph | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OPh | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCHF ₂ | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SH | Pri |

【0144】

【表103】

(110)

特開2002-308857

217

218

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | R ⁹ |
|------------------------------------|------------------------------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|----------------|-----------------------------------|-----------------|
| -(CH ₂) ₂ - | H | H | H | 2 | H | H | H | OEt | CF ₃ |
| -(CH ₂) ₃ - | H | H | H | 2 | H | H | H | OMe | CF ₃ |
| -(CH ₂) ₃ - | H | H | H | 2 | H | H | H | OEt | CF ₃ |
| -(CH ₂) ₄ - | H | H | H | 2 | H | H | H | OMe | CF ₃ |
| -(CH ₂) ₄ - | H | H | H | 2 | H | H | H | OEt | CF ₃ |
| -(CH ₂) ₅ - | H | H | H | 2 | H | H | H | OMe | CF ₃ |
| -(CH ₂) ₅ - | H | H | H | 2 | H | H | H | OEt | CF ₃ |
| H | -(CH ₂) ₃ - | H | H | 2 | H | H | H | OMe | CF ₃ |
| H | -(CH ₂) ₃ - | H | H | 2 | H | H | H | OEt | CF ₃ |
| H | -(CH ₂) ₄ - | H | H | 2 | H | H | H | OMe | CF ₃ |
| H | -(CH ₂) ₄ - | H | H | 2 | H | H | H | OEt | CF ₃ |
| H | -(CH ₂) ₅ - | H | H | 2 | H | H | H | OMe | CF ₃ |
| H | -(CH ₂) ₅ - | H | H | 2 | H | H | H | OEt | CF ₃ |
| H | -(CH ₂) ₆ - | H | H | 2 | H | H | H | OMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | Cl | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OH | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OMe | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OBt | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OPri | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OPr | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OBu ^t | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCH ₂ Pr ^c | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCH ₂ Bu ^c | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCH ₂ Pen ^c | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCH ₂ Hex ^c | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OPen ^c | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OHen ^c | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCH ₂ Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OPh | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCHF ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SH | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SMe | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SO ₂ Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SEt | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SO ₂ Et | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SPri | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SO ₂ Pri | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SPh | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SO ₂ Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SCHF ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SO ₂ CHF ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NH ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NHMe | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NMe ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NHEt | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NMe ₁ | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NHPh | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | N(Me)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | CN | Cl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | F | Me |

【0143】

【表102】

(111)

特開2002-308857

219

220

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | R ⁹ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|----------------|----------------------------------|----------------|
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OH | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OMe | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OEt | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OPr-i | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OPr | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OBu-t | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCH ₂ Pr-i | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCH ₂ Bu-t | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCH ₂ Pen-t | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCH ₂ Hex-t | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OPen-t | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OHex-t | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCH ₂ Ph | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OPh | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCMe ₂ | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SH | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SMe | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SO ₂ Me | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SEt | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SO ₂ Et | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SPr-i | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SO ₂ Pr-i | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SPh | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SO ₂ Ph | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SCHF ₂ | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SO ₂ CHF ₂ | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NH ₂ | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NHMe | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NMe ₂ | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NHEt | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NED ₂ | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NHPh | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | N(Me)Ph | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | CN | Me |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | F | Pr-i |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | Cl | Pr-i |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OH | Pr-i |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OMe | Pr-i |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OEt | Pr-i |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OPr-i | Pr-i |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OPr | Pr-i |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OBu-t | Pr-i |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCH ₂ Pr-i | Pr-i |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCH ₂ Bu-t | Pr-i |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCH ₂ Pen-t | Pr-i |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCH ₂ Hex-t | Pr-i |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OPen-t | Pr-i |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OHex-t | Pr-i |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCH ₂ Ph | Pr-i |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OPh | Pr-i |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCMe ₂ | Pr-i |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SH | Pr-i |

【0144】

【表103】

(112)

特開2002-308857

221

222

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | R ⁹ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|----------------|------------------------------------|----------------|
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SMe | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SO ₂ Me | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SEt | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SO ₂ Et | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SPri | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SO ₂ Pri | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SPh | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SO ₂ Ph | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SCHF ₂ | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SO ₂ CHF ₂ | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NH ₂ | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NHMe | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NMe ₂ | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NHEt | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NEt ₂ | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NHPh | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | N(Me)Ph | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | CN | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | F | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | Cl | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OB | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OMe | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OEt | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OPri | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OPr | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OBu ^t | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCH ₂ Pri | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCH ₂ Bu ^c | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCH ₂ Ph ⁿ c | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCH ₂ Hex ^c | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OPe ⁿ c | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OHex ^c | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCH ₂ Ph | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OPh | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCHF ₂ | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SH | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SMe | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SO ₂ Me | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SEt | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SO ₂ Et | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SPri | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SO ₂ Pri | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SPh | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SO ₂ Ph | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SCHF ₂ | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SO ₂ CHF ₂ | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NH ₂ | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NHMe | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NMe ₂ | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NHEt | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NEt ₂ | Pri |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NHPh | Pri |

【0145】

【表104】

(113)

特開2002-308857

223

224

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | R ⁹ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|----------------|-----------------------------------|------------------|
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | N(Me)Ph | Pr ^c |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | CN | Pr ^c |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | F | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | Cl | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OH | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OMe | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OEt | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OPr-i | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OPr | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OBu-t | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCH ₂ Pr ^c | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCH ₂ Bu ^c | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCH ₂ Pen ^c | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCH ₂ Hex ^c | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OPen ^c | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OHex ^c | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCH ₂ Ph | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OPh | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCHF ₂ | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SH | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SMe | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SO ₂ Me | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SEt | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SO ₂ Et | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SPr-i | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SO ₂ Pr-i | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SPh | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SO ₂ Ph | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SCHF ₂ | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SO ₂ CHF ₂ | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NH ₂ | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NHMe | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NMe ₂ | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NHEt | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NEt ₂ | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NHPh | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | N(Me)Ph | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | CN | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | F | CF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | Cl | CF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OH | CF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OMe | CF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OEt | CF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OPr-i | CF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OPr | CF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OBu-t | CF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCH ₂ Pr ^c | CF ₂ |

【0146】

【表105】

(114)

特開2002-308857

225

226

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | R ⁹ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|----------------|-----------------------------------|-----------------|
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCH ₂ Burc | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCH ₂ Pen ^c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCH ₂ Hex ^c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OPen ^c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OHex ^c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCH ₂ Ph | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OPh | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCHF ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SH | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SO ₂ Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SEt | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SO ₂ Et | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SPri | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SO ₂ Pri | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SPh | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SO ₂ Ph | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SCHF ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SO ₂ CHF ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NH ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NHMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NMe ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NHEt | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NEt ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NHPh | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | N(Me)Ph | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | CN | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | F | OMe |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OH | OMe |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OMe | OMe |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OEt | OMe |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OPri | OMe |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OPr | OMe |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OBu ^t | OMe |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCH ₂ Pri | OMe |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCH ₂ Burc | OMe |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCH ₂ Pen ^c | OMe |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCH ₂ Hex ^c | OMe |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OPen ^c | OMe |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OHex ^c | OMe |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCH ₂ Ph | OMe |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OPh | OMe |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCHF ₂ | OMe |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SH | OMe |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SMe | OMe |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SO ₂ Me | OMe |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SEt | OMe |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SO ₂ Et | OMe |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SPri | OMe |

【0147】

【表106】

(115)

特開2002-308857

227

228

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | R ⁹ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|----------------|----------------------------------|-------------------|
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SO ₂ Pr-i | OMe |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SPh | OMe |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SO ₂ Ph | OMe |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SCHF ₂ | OMe |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SO ₂ CHF ₂ | OMe |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NH ₂ | OMe |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NHMe | OMe |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NMe ₂ | OMe |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NHEt | OMe |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NEt ₂ | OMe |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NHPh | OMe |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NMePh | OMe |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | CN | OMe |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | F | OPh |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OH | OPh |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OMe | OPh |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OEt | OPh |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OPr-i | OPh |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OPr | OPh |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OBu-t | OPh |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCH ₂ Pr-c | OPh |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCH ₂ Bu-c | OPh |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCH ₂ Pen-c | OPh |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCH ₂ Hex-c | OPh |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OPen-c | OPh |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OHex-c | OPh |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCH ₂ Ph | OPh |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OPh | OPh |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCHF ₂ | OPh |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SH | OPh |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SMe | OPh |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SO ₂ Me | OPh |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SEt | OPh |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SO ₂ Et | OPh |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SPr-i | OPh |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SO ₂ Pr-m | OPh |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SPh | OPh |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SO ₂ Ph | OPh |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SCHF ₂ | OPh |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SO ₂ CHF ₂ | OPh |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NH ₂ | OPh |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NHMe | OPh |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NMe ₂ | OPh |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NHEt | OPh |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NEt ₂ | OPh |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NHPh | OPh |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NMePh | OPh |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | CN | OPh |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | F | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OH | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OMe | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OEt | OCHF ₂ |

【0148】

【表107】

(116)

特開2002-308857

229

230

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | R ⁹ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|----------------|----------------------------------|-------------------|
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OPr-i | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OPr | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OBu-t | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCH ₂ Pr-c | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCH ₂ Bu-c | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCH ₂ Pen-c | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCH ₂ Hex-c | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OPen-c | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OHox-c | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCH ₂ Ph | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OPh | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | OCHF ₂ | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SH | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SMe | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SO ₂ Me | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SEt | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SO ₂ Ri | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SPr-i | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SO ₂ Pr-i | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SPh | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SO ₂ Pb | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SCHF ₂ | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | SO ₂ CHF ₂ | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NH ₂ | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NHMe | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NMe ₂ | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NHEt | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NEt ₂ | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | NHPb | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | N(Me)Ph | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | H | CN | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Me | F | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Me | Cl | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Me | OH | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Me | OMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Me | OEt | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Me | OPr-i | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Me | OPr | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Me | OBu-t | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Me | OCH ₂ Pr-c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Me | OCH ₂ Bu-c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Me | OCH ₂ Pen-c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Me | OCH ₂ Hex-c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Me | OPen-c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Me | OHox-c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Me | OCH ₂ Ph | CF ₃ |

【0149】

【表108】

(117)

特開2002-308857

231

232

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | R ⁹ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|----------------|-----------------------------------|-----------------|
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Me | OPh | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Me | OCHF ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Me | SH | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Me | SMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Me | SO ₂ Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Me | SEt | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Me | SO ₂ Et | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Me | SPri | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Me | SO ₂ Pri | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Me | SPh | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Me | SO ₂ Ph | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Me | SUHF ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Me | SO ₂ CHF ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Me | NH ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Me | NHMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Me | NMe ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Me | NHEt | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Me | NEt ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Me | NHPh | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Me | N(Me)Ph | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Me | CN | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OMe | F | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OMe | Cl | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OMe | OH | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OMe | OMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OMe | OEt | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OMe | OPri | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OMe | OPr | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OMe | OBu ^t | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OMe | OCH ₂ Pro | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OMe | OCH ₂ Bu ^c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OMe | OCH ₂ Pen ^c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OMe | OCH ₂ Hex ^c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OMe | OPen ^c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OMe | OHex ^c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OMe | OCH ₂ Ph | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OMe | OPh | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OMe | OCHF ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OMe | SH | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OMe | SMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OMe | SO ₂ Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OMe | SEt | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OMe | SO ₂ Et | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OMe | SPri | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OMe | SO ₂ Pri | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OMe | SPh | CF ₃ |

【0150】

【表109】

(118)

特開2002-308857

233

234

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | R ⁹ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|----------------|-----------------------------------|-----------------|
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OMe | SO ₂ Ph | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OMe | SCHF ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OMe | SO ₂ CHF ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OMe | NH ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OMe | NHMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OMe | NMe ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OMe | NHEt | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OMe | NEt ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OMe | NHPh | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OMe | N(Me)Ph | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | OMe | CN | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SMe | F | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SMe | Cl | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SMe | OH | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SMe | OMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SMe | OEt | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SMe | OPri | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SMe | OPr | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SMe | OBu ^t | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SMe | OCH ₂ Pr ^o | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SMe | OCH ₂ Bu ^o | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SMe | OCH ₂ Pe ^o | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SMe | OCH ₂ Hex ^o | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SMe | OPe ^o | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SMe | OHex ^o | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SMe | OCH ₂ Ph | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SMe | OPh | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SMe | OCHF ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SMe | SH | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SMe | SMc | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SMe | SO ₂ Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SMe | SEt | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SMe | SO ₂ Et | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SMe | SPri | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SMe | SO ₂ Pri | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SMe | SPh | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SMe | SO ₂ Ph | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SMe | SCHF ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SMe | SO ₂ CHF ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SMe | NH ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SMe | NHMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SMe | NMe ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SMe | NHEt | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SMe | NEt ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SMe | NHPh | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SMe | N(Me)Ph | CF ₃ |

【0151】

【表110】

(119)

特開2002-308857

235

236

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ¹¹ | R ¹² | R ¹³ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|--------------------|----------------------------------|-----------------|
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SMe | CN | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SO ₂ Me | F | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SO ₂ Me | Cl | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SO ₂ Me | OH | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SO ₂ Me | OMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SO ₂ Me | OBt | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SO ₂ Me | OPri | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SO ₂ Me | OPr | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SO ₂ Me | OBur | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SO ₂ Me | OCH ₂ Pr-c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SO ₂ Me | OCH ₂ Bur-c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SO ₂ Me | OCH ₂ Pen-c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SO ₂ Me | OCH ₂ Hex-c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SO ₂ Me | OPen-c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SO ₂ Me | OHex-c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SO ₂ Me | OCH ₂ Th | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SO ₂ Me | OPh | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SO ₂ Me | OCHPh | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SO ₂ Me | SH | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SO ₂ Me | SMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SO ₂ Me | SO ₂ Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SO ₂ Me | SEt | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SO ₂ Me | SO ₂ Et | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SO ₂ Me | SPri | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SO ₂ Me | SO ₂ Pri | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SO ₂ Me | SPh | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SO ₂ Me | SO ₂ Ph | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SO ₂ Me | SCHF ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SO ₂ Me | SO ₂ CHF ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SO ₂ Me | NH ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SO ₂ Me | NHMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SO ₂ Me | NMe ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SO ₂ Me | NHEt | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SO ₂ Me | NEt ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SO ₂ Me | NIIPh | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SO ₂ Me | N(Me)Ph | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | SO ₂ Me | CN | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NH ₂ | F | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NH ₂ | Cl | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NH ₂ | OH | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NH ₂ | OMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NH ₂ | OBt | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NH ₂ | OPri | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NH ₂ | OPr | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NH ₂ | OBur | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NH ₂ | OCH ₂ Pr-c | CF ₃ |

【0152】

【表111】

(120)

特開2002-308857

237

238

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | R ⁹ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|-----------------|-------------------------------------|-----------------|
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NH ₂ | OCH ₂ Bu ⁿ c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NH ₂ | OCH ₂ Pen ⁿ c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NH ₂ | OCH ₂ Hex ⁿ c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NH ₂ | OPen ⁿ c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NH ₂ | OHex ⁿ c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NH ₂ | OCH ₂ Pb | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NH ₂ | OPh | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NH ₂ | OCHF ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NH ₂ | SH | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NH ₂ | SMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NH ₂ | SO ₂ Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NH ₂ | SMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NH ₂ | SO ₂ Et | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NH ₂ | SPri | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NH ₂ | SO ₂ Pri | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NH ₂ | SPh | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NH ₂ | SO ₂ Ph | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NH ₂ | SCHF ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NH ₂ | SO ₂ CHF ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NH ₂ | NH ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NH ₂ | NHMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NH ₂ | NMe ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NH ₂ | NHEt | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NH ₂ | NEt ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NH ₂ | NHPh | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NH ₂ | N(Me)Ph | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | NH ₂ | CN | CF ₃ |
| H | H | H | H | 1 | H | H | H | OMe | CF ₃ |
| H | H | H | H | 1 | H | H | H | OEt | CF ₃ |
| Me | H | H | H | 1 | H | H | H | OMe | CF ₃ |
| Me | H | H | H | 1 | H | H | H | OEt | CF ₃ |
| Me | H | Me | H | 1 | H | H | H | OMe | CF ₃ |
| Me | H | Me | H | 1 | H | H | H | OEt | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | Me | H | H | OMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | Me | H | H | OEt | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | Et | H | H | OMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | Et | H | H | OEt | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | Pri | H | H | H | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | Pri | H | H | OMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | Pri | H | H | OEt | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | Me | Me | H | OMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 1 | Me | Me | H | OEt | CF ₃ |
| Me | Et | H | H | 1 | H | H | H | OMe | CF ₃ |
| Me | Et | H | H | 1 | H | H | H | OEt | CF ₃ |
| Et | Et | H | H | 1 | H | H | H | OMe | CF ₃ |
| Et | Et | H | H | 1 | H | H | H | OEt | CF ₃ |

【0153】

【表112】

(121)

特開2002-308857

239

240

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | R ⁹ |
|----------------------------------|---------------------------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|----------------|-------------------------------|-----------------|
| Me | Pr <i>i</i> | H | H | 1 | H | H | H | OMe | CF ₃ |
| Me | Pr <i>i</i> | H | H | 1 | H | H | H | OEt | CF ₃ |
| Me | Pr | H | H | 1 | H | H | H | OMe | CF ₃ |
| Me | Pr <i>c</i> | H | H | 1 | H | H | H | OEt | CF ₃ |
| Me | Pr <i>c</i> | H | H | 1 | H | H | H | OMe | CF ₃ |
| Me | CH ₂ Pr <i>c</i> | H | H | 1 | H | H | H | OEt | CF ₃ |
| Me | CH ₂ Pr <i>c</i> | H | H | 1 | H | H | H | OMe | CF ₃ |
| (CH ₂) ₂ | | H | H | 1 | H | H | H | OEt | CF ₃ |
| (CH ₂) ₃ | | H | H | 1 | H | H | H | OMe | CF ₃ |
| (CH ₂) ₄ | | H | H | 1 | H | H | H | OEt | CF ₃ |
| (CH ₂) ₅ | | H | H | 1 | H | H | H | OMe | CF ₃ |
| (CH ₂) ₆ | | H | H | 1 | H | H | H | OEt | CF ₃ |
| (CH ₂) ₇ | | H | H | 1 | H | H | H | OMe | CF ₃ |
| (CH ₂) ₈ | | H | H | 1 | H | H | H | OEt | CF ₃ |
| (CH ₂) ₉ | | H | H | 1 | H | H | H | OMe | CF ₃ |
| (CH ₂) ₁₀ | | H | H | 1 | H | H | H | OEt | CF ₃ |
| H | (CH ₂) ₃ | H | H | 1 | H | H | H | OMe | CF ₃ |
| H | (CH ₂) ₄ | H | H | 1 | H | H | H | OEt | CF ₃ |
| H | (CH ₂) ₅ | H | H | 1 | H | H | H | OMe | CF ₃ |
| H | (CH ₂) ₆ | H | H | 1 | H | H | H | OEt | CF ₃ |
| H | (CH ₂) ₇ | H | H | 1 | H | H | H | OMe | CF ₃ |
| H | (CH ₂) ₈ | H | H | 1 | H | H | H | OEt | CF ₃ |
| H | (CH ₂) ₉ | H | H | 1 | H | H | H | OMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | Cl | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OH | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OMe | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OEt | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OPr <i>i</i> | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OPr | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | ORu <i>t</i> | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OCH ₂ Pr <i>c</i> | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OCH ₂ Bu <i>c</i> | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OCH ₂ Pen <i>c</i> | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OCH ₂ Hex <i>c</i> | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OPen <i>c</i> | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OHex <i>c</i> | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OCH ₂ Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OPh | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OCHF ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SH | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SMe | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SO ₂ Me | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SEt | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SO ₂ Et | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SPr <i>i</i> | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SO ₂ Pr <i>i</i> | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SPh | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SO ₂ Ph | Cl |

【0154】

【表113】

(122)

特開2002-308857

241

242

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | R ⁹ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|----------------|-----------------------------------|----------------|
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SCHF ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SO ₂ CHF ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | NH ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | NHMe | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | NMe ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | NHEt | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | NEt ₂ | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | NHPh | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | N(Me)Ph | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | CN | Cl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | F | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | Cl | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OH | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OMe | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OGt | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OPri | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OPr | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OBur | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OCH ₂ Pr ^c | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OCH ₂ Bur ^c | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OCH ₂ Pe ^c | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OCH ₂ Hex ^c | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OPen ^c | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OHox ^c | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OCH ₂ Ph | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OPh | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OCHF ₂ | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SH | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SMe | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SO ₂ Me | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SEt | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SO ₂ Et | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SPri | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SO ₂ Pr ⁱ | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SPh | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SO ₂ Ph | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SCHF ₂ | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SO ₂ CHF ₂ | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | NH ₂ | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | NHMe | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | NMe ₂ | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | NHEt | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | NEt ₂ | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | NHPh | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | N(Me)Ph | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | CN | Me |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | F | Pri |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | Cl | Pri |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OH | Pri |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OMe | Pri |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OPr | Pri |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OPri | Pri |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OPr | Pri |

【0155】

【表114】

(123)

特開2002-308857

243

244

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | R ⁹ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|----------------|------------------------------------|-----------------|
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OBu ^t | Pr ⁱ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OCH ₂ Pr ^c | Pr ⁱ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OCH ₂ Bu ^c | Pr ⁱ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OCH ₂ Pen ^c | Pr ⁱ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OCH ₂ Hex ^c | Pr ⁱ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OPen ^c | Pr ⁱ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OHex ^c | Pr ⁱ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OCH ₂ Ph | Pr ⁱ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OPh | Pr ⁱ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OCHF ₃ | Pr ⁱ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SH | Pr ⁱ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SMe | Pr ⁱ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SO ₂ Me | Pr ⁱ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SEt | Pr ⁱ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SO ₂ Et | Pr ⁱ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SPri | Pr ⁱ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SO ₂ Pr ⁱ | Pr ⁱ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SPh | Pr ⁱ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SO ₂ Ph | Pr ⁱ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SO ₂ CH ₂ Ph | Pr ⁱ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SO ₂ CH ₂ Ph | Pr ⁱ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | NH ₂ | Pr ⁱ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | NHMe | Pr ⁱ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | NMe ₂ | Pr ⁱ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | NHEt | Pr ⁱ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | NEt ₂ | Pr ⁱ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | NHPh | Pr ⁱ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | N(Me)Ph | Pr ⁱ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | CN | Pr ⁱ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | F | Pr ^c |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | Cl | Pr ^c |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OH | Pr ^c |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OMe | Pr ^c |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OEt | Pr ^c |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OPri | Pr ^c |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OPr | Pr ^c |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OBu ^t | Pr ^c |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OCH ₂ Pr ^c | Pr ^c |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OCH ₂ Bu ^c | Pr ^c |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OCH ₂ Pen ^c | Pr ^c |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OCH ₂ Hex ^c | Pr ^c |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OPen ^c | Pr ^c |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OHex ^c | Pr ^c |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OCH ₂ Ph | Pr ^c |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OPh | Pr ^c |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OCHF ₃ | Pr ^c |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SH | Pr ^c |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SMe | Pr ^c |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SO ₂ Me | Pr ^c |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SEt | Pr ^c |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SO ₂ Et | Pr ^c |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SPri | Pr ^c |

[0156]

[表115]

JP,2002-308857,A

© STANDARD

ZOOM-UP ROTATION

No Rotation



VERSAL

RELOAD

PREVIOUS PAGE

NEXT PAGE

DETAIL

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | R ⁹ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|----------------|----------------------------------|------------------|
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SO ₂ Pr-i | Pr-c |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SPh | Pr-c |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SO ₂ Ph | Pr-c |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SCHF ₂ | Pr-c |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SO ₂ CHF ₂ | Pr-c |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | NH ₂ | Pr-c |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | NHMe | Pr-c |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | NMe ₂ | Pr-c |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | NHEt | Pr-c |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | NEt ₂ | Pr-c |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | NHPh | Pr-c |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | N(Me)Ph | Pr-c |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | CN | Pr-c |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | F | CHF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | Cl | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | CH ₃ | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OMe | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OEt | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OPr-i | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OPr | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OBu-t | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OCH ₂ Pr-c | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OCH ₂ Bu-c | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OCH ₂ Pen-c | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OCH ₂ Hex-c | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OPen-c | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OH ₂ Hex-c | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OCH ₂ Ph | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OPh | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OCHF ₂ | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SH | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SMe | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SO ₂ Me | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SEt | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SO ₂ Et | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SPr-i | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SO ₂ Pr-i | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SPh | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SO ₂ Ph | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SCHF ₂ | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SO ₂ CHF ₂ | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | NH ₂ | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | NHMe | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | NMe ₂ | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | NHEt | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | NEt ₂ | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | NHPh | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | N(Me)Ph | CHF ₂ |

【0157】

【表116】

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | R ⁹ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|----------------|----------------------------------|------------------|
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | CN | CHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | F | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | Cl | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OH | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OBz | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OPr-i | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OPr | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OBu-t | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OCH ₂ Pr-c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OCH ₂ Bu-c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OCH ₂ Pen-c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OCH ₂ Hex-c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OPen-c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OHex-c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OCH ₂ Pb | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OPh | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OCHF ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SH | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SO ₂ Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SEt | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SO ₂ Et | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SPr-i | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SO ₂ Pr-i | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SPh | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SO ₂ Ph | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SCHF ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SO ₂ CHF ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | NH ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | NHMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | NMe ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | NHF ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | NEt ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | NHPh | CF ₃ |
| Bz | Me | H | H | 0 | H | H | H | N(Me)Ph | CF ₃ |
| Bz | Me | H | H | 0 | H | H | H | CN | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | F | OMe |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OH | OMe |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OMe | OMe |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OBz | OMe |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OPr-i | OMe |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OPr | OMe |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OBu-t | OMe |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OCH ₂ Pr-c | OMe |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OCH ₂ Bu-c | OMe |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OCH ₂ Pen-c | OMe |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OCH ₂ Hex-c | OMe |

【0158】

【表117】

(126)

特開2002-308857

249

250

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | R ⁹ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|----------------|-----------------------------------|----------------|
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OPen-c | OMe |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OHex-c | OMe |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OCH ₂ Ph | OMe |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OPh | OMe |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OCHF ₂ | OMe |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SH | OMe |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SMe | OMe |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SO ₂ Me | OMe |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SEt | OMe |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SO ₂ Et | OMe |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SPri | OMe |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SO ₂ Pri | OMe |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SPh | OMe |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SO ₂ Ph | OMe |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SCHF ₂ | OMe |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SO ₂ CHF ₂ | OMe |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | NH ₂ | OMe |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | NHMe | OMe |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | NMe ₂ | OMe |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | NHEt | OMe |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | NEt ₂ | OMe |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | NHPh | OMe |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | N(Me)Ph | OMe |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | CN | OMe |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | F | OPh |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OH | OPh |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OMe | OPh |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OEt | OPh |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OPri | OPh |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OPr | OPh |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OBu ^t | OPh |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OCH ₂ Pr ^c | OPh |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OCH ₂ Bu ^c | OPh |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OCH ₂ Pen ^c | OPh |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OCH ₂ Hex ^c | OPh |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OPen-c | OPh |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OHex-c | OPh |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OCH ₂ Ph | OPh |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OPh | OPh |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OCHF ₂ | OPh |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SH | OPh |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SMe | OPh |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SO ₂ Me | OPh |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SEt | OPh |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SO ₂ Et | OPh |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SPri | OPh |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SO ₂ Pri | OPh |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SPh | OPh |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SO ₂ Ph | OPh |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SCHF ₂ | OPh |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SO ₂ CHF ₂ | OPh |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | NH ₂ | OPh |

【0159】

【表118】

(127)

特開2002-308857

251

252

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | R ⁹ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|----------------|------------------------|-------------------|
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | NHMe | OPh |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | NMe ₂ | OPh |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | NHEt | OPh |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | NEt ₂ | OPh |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | NHPh | OPh |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | N(Me)Ph | OPh |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | CN | OPh |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | F | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OH | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OMe | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OEt | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OPr-i | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OPr | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OPr-t | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OCH ₂ Pr-c | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OCH ₂ Bur-c | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OCH ₂ Pen-c | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OCH ₂ Hex-c | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OPen-c | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OHex-c | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OCH ₂ Ph | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OPh | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OCHF ₂ | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SH | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SMe | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SO ₂ Me | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SEt | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SO ₂ Et | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SPr-i | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SO ₂ Pr-i | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SPh | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SO ₂ Ph | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SCHF ₂ | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | SO ₂ CHPh | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | NH ₂ | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | NHMe | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | NMe ₂ | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | NHEt | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | NEt ₂ | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | NHPh | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | N(Me)Ph | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | CN | OCHF ₂ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Me | F | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Me | Cl | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Me | OH | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Me | OMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Me | OEt | CF ₃ |

【0160】

【表119】

(128)

特開2002-308857

253

254

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | R ⁹ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|----------------|----------------------------------|-----------------|
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Me | OPr-i | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Me | OPr | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Me | OBur | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Me | OCH ₂ Pr-c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Me | OCH ₂ Bur-c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Me | OCH ₂ Pen-c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Me | OCH ₂ Hex-c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Me | OPen-c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Me | OHex-c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Me | OCH ₂ Ph | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Me | OPh | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Me | OCHF ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Me | SH | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Me | SMc | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Me | SO ₂ Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Me | SEt | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Me | SO ₂ Bt | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Me | SPr-i | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Me | SO ₂ Pr-i | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Me | SPh | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Me | SO ₂ Ph | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Me | SCHF ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Me | SO ₂ CHF ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Me | NH ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Me | NHMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Me | NMe ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Me | NHEt | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Me | NPh ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Me | NHPh | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Me | N(Me)Ph | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Me | CN | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OMe | F | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OMe | Cl | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OMe | OH | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OMe | OMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OMe | OEt | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OMe | OPr-i | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OMe | OPr | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OMe | OBu-L | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OMe | OCH ₂ Pr-c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OMe | OCH ₂ Bur-c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OMe | OCH ₂ Pen-c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OMe | OCH ₂ Hex-c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OMe | OPen-c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OMe | OHex-c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OMe | OCH ₂ Ph | CF ₃ |

[0161]

[表120]

(129)

特開2002-308857

255

256

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | R ⁹ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|----------------|----------------------------------|-----------------|
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OMe | OPh | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OMe | OCHF ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OMe | SH | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OMe | SMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OMe | SO ₂ Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OMe | SEt | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OMe | SO ₂ Et | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OMe | SPri | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OMe | SO ₂ Pri | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OMe | SPh | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OMe | SO ₂ Ph | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OMe | SCHF ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OMe | SO ₂ CHF ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OMe | NH ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OMe | NHMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OMe | NMe ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OMe | NHEt | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OMe | NEt ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OMe | NHPh | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OMe | N(OMe)Ph | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | OMe | CN | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SMe | F | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SMe | Cl | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SMe | OH | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SMe | OMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SMe | OEt | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SMe | OPri | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SMe | OPr | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SMe | OBur | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SMe | OCH ₂ Pri | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SMe | OCH ₂ Bur | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SMe | OCH ₂ Pen | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SMe | OCH ₂ Hex | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SMe | OPent | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SMe | OHex | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SMe | OCH ₂ Ph | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SMe | OPh | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SMe | OCHF ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SMe | SH | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SMe | SMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SMe | SO ₂ Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SMe | SEt | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SMe | SO ₂ Et | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SMe | SPri | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SMe | SO ₂ Pri | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SMe | SPh | CF ₃ |

【0162】

【表121】

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | R ⁹ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|--------------------|--|-----------------|
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SMe | SO ₂ Ph | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SMe | SCHF ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SMe | SO ₂ CH ₂ F ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SMe | NH ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SMe | NHMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SMe | NMe ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SMe | NHEt | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SMe | NEt ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SMe | NHPh | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SMe | N(Me)Ph | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SMe | CN | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SO ₂ Me | F | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SO ₂ Me | Cl | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SO ₂ Me | OH | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SO ₂ Me | OMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SO ₂ Me | OEt | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SO ₂ Me | OPr ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SO ₂ Me | OPr | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SO ₂ Me | OBu ^t | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SO ₂ Me | OCH ₂ Pr ^c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SO ₂ Me | OCH ₂ Bu ^c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SO ₂ Me | OCH ₂ Pen ^c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SO ₂ Me | OCH ₂ Hex ^c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SO ₂ Me | OPen ^c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SO ₂ Me | OHex ^c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SO ₂ Me | OCH ₂ Ph | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SO ₂ Me | OPh | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SO ₂ Me | OCHF ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SO ₂ Me | SH | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SO ₂ Me | SMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SO ₂ Me | SO ₂ Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SO ₂ Me | SEt | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SO ₂ Me | SO ₂ Et | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SO ₂ Me | SPr ¹ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SO ₂ Me | SO ₂ Pr ⁱ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SO ₂ Me | SPh | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SO ₂ Me | SO ₂ Ph | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SO ₂ Me | SCHF ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SO ₂ Me | SO ₂ CH ₂ F ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SO ₂ Me | NH ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SO ₂ Me | NHMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SO ₂ Me | NMe ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SO ₂ Me | NHEt | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SO ₂ Me | NEt ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SO ₂ Me | NHPh | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SO ₂ Me | N(Me)Ph | CF ₃ |

【0163】

【表122】

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | R ⁹ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|--------------------|-----------------------------------|-----------------|
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | SO ₂ Me | CN | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NH ₂ | F | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NH ₂ | Cl | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NH ₂ | OH | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NH ₂ | OMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NH ₂ | OEt | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NH ₂ | OPr ⁱ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NH ₂ | OPr ^t | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NH ₂ | OBu ^t | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NH ₂ | OCH ₂ Pr ^c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NH ₂ | OCH ₂ Bu ^c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NH ₂ | OCH ₂ Pen ^c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NH ₂ | OCH ₂ Hex ^c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NH ₂ | OPen ^c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NH ₂ | OHex ^c | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NH ₂ | OCH ₂ Ph | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NH ₂ | OPh | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NH ₂ | OCHF ₃ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NH ₂ | SH | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NH ₂ | SMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NH ₂ | SO ₂ Me | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NH ₂ | SEt | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NH ₂ | SO ₂ R ^t | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NH ₂ | SP ⁱ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NH ₂ | SO ₂ Pr ⁱ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NH ₂ | SPh | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NH ₂ | SO ₂ Ph | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NH ₂ | SCl ₂ Ph | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NH ₂ | SO ₂ CHF ₃ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NH ₂ | NH ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NH ₂ | NHMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NH ₂ | NMe ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NH ₂ | NHEt | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NH ₂ | NEt ₂ | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NH ₂ | NHPh | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NH ₂ | N(Me)Ph | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | NH ₂ | CN | CF ₃ |
| H | H | H | H | 0 | H | H | H | OMe | CF ₃ |
| H | H | H | H | 0 | H | H | H | OEt | CF ₃ |
| Me | H | H | H | 0 | H | H | H | OMe | CF ₃ |
| Me | H | H | H | 0 | H | H | H | OEt | CF ₃ |
| Me | H | Me | H | 0 | H | H | H | OMe | CF ₃ |
| Me | H | Me | H | 0 | H | H | H | OEt | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | Me | H | H | OMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | Me | H | H | OEt | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | Et | H | H | OMe | CF ₃ |

【0164】

【表123】

(132)

特開2002-308857

261

262

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | R ⁹ |
|----------------|-------------------------------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|----------------|----------------|-----------------|
| Me | Me | H | H | 0 | Et | H | H | OEt | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | Pr-i | H | H | H | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | Pr-i | H | H | OMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | Pr-i | H | H | OEt | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | Me | Me | H | OMe | CF ₃ |
| Me | Me | H | H | 0 | Me | Me | H | OEt | CF ₃ |
| Me | Et | H | H | 0 | H | H | H | OMe | CF ₃ |
| Me | Et | H | H | 0 | H | H | H | OEt | CF ₃ |
| Et | Et | H | H | 0 | H | H | H | OMe | CF ₃ |
| Et | Et | H | H | 0 | H | H | H | OEt | CF ₃ |
| Me | Pr-i | H | H | 0 | H | H | H | OMe | CF ₃ |
| Me | Pr-i | H | H | 0 | H | H | H | OEt | CF ₃ |
| Me | Pr | H | H | 0 | H | H | H | OMe | CF ₃ |
| Me | Pr | H | H | 0 | H | H | H | OEt | CF ₃ |
| Me | Pr-c | H | H | 0 | H | H | H | OMe | CF ₃ |
| Me | Pr-c | H | H | 0 | H | H | H | OEt | CF ₃ |
| Me | CH ₃ Pr-c | H | H | 0 | H | H | H | OMe | CF ₃ |
| Me | CH ₃ Pr-c | H | H | 0 | H | H | H | OEt | CF ₃ |
| | -(CH ₂) ₂ - | H | H | 0 | H | H | H | OMe | CF ₃ |
| | -(CH ₂) ₃ - | H | H | 0 | H | H | H | OEt | CF ₃ |
| | -(CH ₂) ₄ - | H | H | 0 | H | H | H | OMe | CF ₃ |
| | -(CH ₂) ₅ - | H | H | 0 | H | H | H | OEt | CF ₃ |
| | -(CH ₂) ₆ - | H | H | 0 | H | H | H | OMe | CF ₃ |
| | -(CH ₂) ₇ - | H | H | 0 | H | H | H | OEt | CF ₃ |
| | -(CH ₂) ₈ - | H | H | 0 | H | H | H | OMe | CF ₃ |
| | -(CH ₂) ₉ - | H | H | 0 | H | H | H | OEt | CF ₃ |
| | -(CH ₂) ₁₀ - | H | H | 0 | H | H | H | OMe | CF ₃ |
| | -(CH ₂) ₁₁ - | H | H | 0 | H | H | H | OEt | CF ₃ |
| | -(CH ₂) ₁₂ - | H | H | 0 | H | H | H | OMe | CF ₃ |
| | -(CH ₂) ₁₃ - | H | H | 0 | H | H | H | OEt | CF ₃ |
| | -(CH ₂) ₁₄ - | H | H | 0 | H | H | H | OMe | CF ₃ |
| | -(CH ₂) ₁₅ - | H | H | 0 | H | H | H | OEt | CF ₃ |
| | -(CH ₂) ₁₆ - | H | H | 0 | H | H | H | OMe | CF ₃ |
| | -(CH ₂) ₁₇ - | H | H | 0 | H | H | H | OEt | CF ₃ |

【0165】

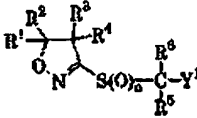
【表124】

(133)

特開2002-308857

263

264

|  | | | | | | | | | |
|---|------------------------------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|---|--|--|
| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | Y ¹ | | |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Pyridin-2-yl | | |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Pyridin-2-yl 1-oxide | | |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Pyridin-4-yl | | |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Pyridin-4-yl 1-oxide | | |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | 1,2,4-Oxadiazol-3-yl | | |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | 3-Phenyl-1,2,4-oxadiazol-5-yl | | |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | 3-Benzyl-1,2,4-oxadiazol-5-yl | | |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | 2-Chlorothiazol-4-yl | | |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | 5-Trifluoromethyl-1,3,4-thiadiazol-2-yl | | |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | 1,4-Dimethylimidazol-5-yl | | |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | 1-Phenyl-4-methoxycarbonyl-1,2,3-triazol-5-yl | | |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | 1-Difluoromethyl-1,2,4-triazol-3-yl | | |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | 1-Difluoromethyl-1,3,4-triazol-5-yl | | |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | 4-Difluoromethyl-1,2,4-triazol-3-yl | | |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl | | |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | 4,6-Diethoxypyrimidin-2-yl | | |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | 4,6-Dimethylpyrimidin-2-yl | | |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | 4-Chloro-6-methylpyrimidin-2-yl | | |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | 4-Methoxy-6-methylpyrimidin-2-yl | | |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | 4-Difluoromethoxy-6-methylpyrimidin-2-yl | | |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | 4-Phenoxy-6-methylpyrimidin-2-yl | | |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | 4-Chloro-6-trifluoromethylpyrimidin-2-yl | | |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | 4-Methoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-2-yl | | |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | 4-Difluoromethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-2-yl | | |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | 4-Phenoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-2-yl | | |
| H | H | H | H | 2 | H | H | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl | | |
| Me | H | H | H | 2 | H | H | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl | | |
| Me | H | Me | H | 2 | H | H | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl | | |
| Me | Me | H | H | 2 | Me | H | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl | | |
| Me | Me | H | H | 2 | Et | H | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl | | |
| Me | Me | H | H | 2 | Pr-i | H | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl | | |
| Me | Me | H | H | 2 | Me | Me | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl | | |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl | | |
| Et | Et | H | H | 2 | H | H | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl | | |
| Me | Pr-i | H | H | 2 | H | H | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl | | |
| Me | Pr | H | H | 2 | H | H | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl | | |
| Me | Pr-c | H | H | 2 | H | H | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl | | |
| Me | CH ₂ Pr-c | H | H | 2 | H | H | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl | | |
| | -(CH ₂) ₂ - | H | H | 2 | H | H | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl | | |
| | -(CH ₂) ₃ - | H | H | 2 | H | H | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl | | |
| | -(CH ₂) ₄ - | H | H | 2 | H | H | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl | | |
| | -(CH ₂) ₅ - | H | H | 2 | H | H | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl | | |

[0166]

【表125】

(134)

特開2002-308857

265

266

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ^h | R ^c | Y ⁱ |
|----------------|------------------------------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|---|
| H | -(CH ₂) ₃ - | H | H | 2 | H | H | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl |
| H | -(CH ₂) ₄ - | H | H | 2 | H | H | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl |
| H | -(CH ₂) ₆ - | H | H | 2 | H | H | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl |
| H | -(CH ₂) ₈ - | H | H | 2 | H | H | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Pyridin-2-yl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Pyridin-2-yl 1-oxide |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Pyridin-4-yl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Pyridin-4-yl 1-oxide |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | 1,3,4-Oxadiazol-3-yl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | 3-Phenyl-1,2,4-oxadiazol-5-yl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | 3-Benzyl-1,2,4-oxadiazol-5-yl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | 2-Chlorothiazol-4-yl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | 5-Trifluoromethyl-1,3,4-thiadiazol-2-yl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | 1,4-Dimethylimidazol-5-yl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | 1-Phenyl-4-methoxycarbonyl-1,2,3-triazol-5-yl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | 1-Difluoromethyl-1,2,4-triazol-3-yl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | 1-Difluoromethyl-1,2,4-triazol-5-yl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | 4-Difluoromethyl-1,2,4-triazol-3-yl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | 4,6-Diethoxypyrimidin-2-yl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | 4,6-Dimethylpyrimidin-2-yl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | 4-Chloro-6-methylpyrimidin-2-yl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | 4-Methoxy-6-methylpyrimidin-2-yl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | 4-Difluoromethoxy-6-methylpyrimidin-2-yl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | 4-Phenoxy-6-methylpyrimidin-2-yl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | 4-Chloro-6-trifluoromethylpyrimidin-2-yl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | 4-Methoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-2-yl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | 4-Difluoromethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-2-yl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | 4-Phenoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-2-yl |
| H | H | H | H | 1 | H | H | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl |
| Me | H | H | H | 1 | H | H | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl |
| Me | H | Me | H | 1 | H | H | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl |
| Me | Me | H | H | 1 | Me | H | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl |
| Me | Me | H | H | 1 | Et | H | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl |
| Me | Me | H | H | 1 | Pr-i | H | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl |
| Me | Me | H | H | 1 | Me | Me | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl |
| Me | Et | H | H | 1 | H | H | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl |
| Et | Et | H | H | 1 | H | H | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl |
| Me | Pr-i | H | H | 1 | H | H | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl |
| Me | Pr | H | H | 1 | H | H | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl |
| Me | Pr-c | H | H | 1 | H | H | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl |
| Me | CH ₂ Pr-c | H | H | 1 | H | H | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl |
| | -(CH ₂) ₃ - | H | H | 1 | H | H | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl |
| | -(CH ₂) ₄ - | H | H | 1 | H | H | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl |
| | -(CH ₂) ₆ - | H | H | 1 | H | H | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl |
| | -(CH ₂) ₈ - | H | H | 1 | H | H | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl |
| H | -(CH ₂) ₉ - | H | H | 1 | H | H | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl |

[0167]

[表126]

(135)

特開2002-308857

267

268

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | Y ¹ |
|----------------|------------------------------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|---|
| H | -(CH ₂) ₄ - | H | H | 1 | H | H | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl |
| H | -(CH ₂) ₆ - | H | H | 1 | H | H | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl |
| H | -(CH ₂) ₆ - | H | H | 1 | H | H | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Pyridin-2-yl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Pyridin-2-yl 1-oxide |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Pyridin-4-yl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Pyridin-4-yl 1-oxide |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | 1,2,4-Oxadiazol-3-yl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | 3-Phenyl-1,2,4-oxadiazol-5-yl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | 3-Benzyl-1,2,4-oxadiazol-5-yl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | 2-Chlorothiazol-4-yl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | 5-Trifluoromethyl-1,3,4-thiadiazol-2-yl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | 1,4-Dimethylimidazol-5-yl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | 1-Phenyl-4-methoxycarbonyl-1,2,3-triazol-5-yl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | 1-Difluoromethyl-1,2,4-triazol-3-yl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | 1-Difluoromethyl-1,2,4-triazol-5-yl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | 4-Difluoromethyl-1,2,4-triazol-3-yl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | 4,6-Diethoxypyrimidin-2-yl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | 4,6-Dimethylpyrimidin-2-yl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | 4-Chloro-6-methylpyrimidin-2-yl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | 4-Methoxy-6-methylpyrimidin-2-yl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | 4-Difluoromethoxy-6-methylpyrimidin-2-yl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | 4-Phenoxy-6-methylpyrimidin-2-yl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | 4-Chloro-6-trifluoromethylpyrimidin-2-yl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | 4-Methoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-2-yl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | 4-Difluoromethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-2-yl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | 4-Phenoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-2-yl |
| H | H | H | H | 0 | H | H | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl |
| Me | H | H | H | 0 | H | H | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl |
| Me | H | Me | H | 0 | H | H | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl |
| Me | Me | H | H | 0 | Me | H | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl |
| Me | Me | H | H | 0 | Et | H | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl |
| Me | Me | H | H | 0 | Pr-i | H | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl |
| Me | Me | H | H | 0 | Me | Me | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl |
| Me | Et | H | H | 0 | H | H | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl |
| Et | Et | H | H | 0 | H | H | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl |
| Me | Pr-i | H | H | 0 | H | H | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl |
| Me | Pr | H | H | 0 | H | H | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl |
| Me | Pr-c | H | H | 0 | H | H | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl |
| Me | CH ₂ Pr-c | H | H | 0 | H | H | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl |
| | -(CH ₂) ₇ - | H | H | 0 | H | H | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl |
| | -(CH ₂) ₇ - | H | H | 0 | H | H | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl |
| | -(CH ₂) ₆ - | H | H | 0 | H | H | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl |
| | -(CH ₂) ₅ - | H | H | 0 | H | H | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl |
| H | -(CH ₂) ₇ - | H | H | 0 | H | H | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl |
| H | -(CH ₂) ₆ - | H | H | 0 | H | H | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl |

[0168]

[表127]

(136)

特開2002-308857

269

270

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | Y ¹ |
|----------------|------------------------------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|-----------------------------|
| H | -(CH ₂) ₆ - | H | H | 0 | H | H | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl |
| H | -(CH ₂) ₆ - | H | H | 0 | H | H | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | Pirrol-1-yl |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | Oxazol-2-yl |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | Thiazol-2-yl |
| Me | Et | H | H | 3 | H | H | Thiazol-4-yl |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | 1,2,3-Thiadiazol-4-yl |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | 1,2,3-Thiadiazol-6-yl |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | 1,2,4-Thiadiazol-3-yl |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | 1,2,4-Thiadiazol-5-yl |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | 1,3,4-Thiadiazol-2-yl |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | 1,3,4-Thiadiazol-5-yl |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | Pyridin-2-yl |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | Pyridin-3-yl |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | Pyridin-4-yl |
| Me | Et | H | H | 3 | H | H | 1H-Imidazol-2-yl |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | 1H-Imidazol-4-yl |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | 1H-Imidazol-6-yl |
| Me | Et | H | H | 3 | H | H | 1H-1,3,4-Triazol-2-yl |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | 1H-1,3,4-Triazol-5-yl |

【0169】

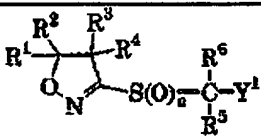
【表128】

(137)

特開2002-308857

271

272

|  | | | | | | | |
|---|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|------------------------------|
| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | Y ¹ |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Benzimidazol-2-yl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Benzo[thiophen]-2-yl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | 3-Chlorobenzo[thiophen]-2-yl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Benzo[triazol]-1-yl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | 1-Methylindazol-4-yl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Benzo[thiazol]-2-yl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Benzo[thiophen]-3-yl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | 5-Chlorobenzo[thiophen]-3-yl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Benzo[xazol]-2-yl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | 3-Methylbenzo[thiophen]-2-yl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | 3-Bromobenzo[thiophen]-2-yl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Benzo[furan]-2-yl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | 2-Methylbenzo[furan]-7-yl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | 3-Bromobenzo[furan]-2-yl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | Benzo[thiophen]-7-yl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | 1-Methylindazol-7-yl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | 1-Difluoromethylindazol-7-yl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | 3-Methylbenzo[furan]-2-yl |
| Me | Me | H | H | 2 | H | H | 3-Chloro-1-methylindol-2-yl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Benzimidazol-2-yl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Benzo[thiophen]-2-yl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | 3-Chlorobenzo[thiophen]-2-yl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Benzo[triazol]-1-yl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | 1-Methylindazol-4-yl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Benzo[thiazol]-2-yl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Benzo[thiophen]-3-yl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | 5-Chlorobenzo[thiophen]-3-yl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Benzo[xazol]-2-yl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | 3-Methylbenzo[thiophen]-2-yl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | 3-Bromobenzo[thiophen]-2-yl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Benzo[furan]-2-yl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | 2-Methylbenzo[furan]-7-yl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | 3-Bromobenzo[furan]-2-yl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | Benzo[thiophen]-7-yl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | 1-Methylindazol-7-yl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | 3-Methylbenzo[furan]-2-yl |
| Me | Me | H | H | 1 | H | H | 3-Chloro-1-methylindol-2-yl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Benzimidazol-2-yl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Benzo[thiophen]-2-yl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | 3-Chlorobenzo[thiophen]-2-yl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Benzo[triazol]-1-yl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | 1-Methylindazol-4-yl |

【0170】

【表129】

(138)

特開2002-308857

273

274

| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | Y ¹ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|------------------------------|
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Benzo[thiazol-2-yl] |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Benzo[thiophen-3-yl] |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | 5-Chlorobenzo[thiophen-3-yl] |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Benzo[oxazol-2-yl] |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | 3-Methylbenzo[thiophen-2-yl] |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | 3-Bromobenzo[thiophen-2-yl] |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Benzo[furan-2-yl] |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | 2-Methylbenzo[furan-7-yl] |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | 3-Bromobenzo[furan-2-yl] |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | Benzo[thiophen-7-yl] |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | 1-Methylindazol-7-yl |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | 3-Methylbenzo[furan-2-yl] |
| Me | Me | H | H | 0 | H | H | 3-Chloro-1-methylindol-2-yl |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | Benzo[oxazol-2-yl] |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | 4-Chlorobenzo[oxazol-2-yl] |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | 5-Chlorobenzo[oxazol-2-yl] |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | 6-Chlorobenzo[oxazol-2-yl] |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | 7-Chlorobenzo[oxazol-2-yl] |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | 4-Fluorobenzo[oxazol-2-yl] |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | 5-Fluorobenzo[oxazol-2-yl] |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | 6-Fluorobenzo[oxazol-2-yl] |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | 7-Fluorobenzo[oxazol-2-yl] |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | 4-Methylbenzo[oxazol-2-yl] |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | 5-Methylbenzo[oxazol-2-yl] |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | 6-Methylbenzo[oxazol-2-yl] |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | 7-Methylbenzo[oxazol-2-yl] |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | 4-Methoxybenzo[oxazol-2-yl] |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | 5-Methoxybenzo[oxazol-2-yl] |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | 6-Methoxybenzo[oxazol-2-yl] |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | 7-Methoxybenzo[oxazol-2-yl] |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | Benzo[thiazol-2-yl] |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | 4-Chlorobenzo[thiazol-2-yl] |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | 5-Chlorobenzo[thiazol-2-yl] |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | 6-Chlorobenzo[thiazol-2-yl] |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | 7-Chlorobenzo[thiazol-2-yl] |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | 4-Fluorobenzo[thiazol-2-yl] |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | 5-Fluorobenzo[thiazol-2-yl] |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | 6-Fluorobenzo[thiazol-2-yl] |

[0171]

[表130]

(139)

特開2002-308857

275

276

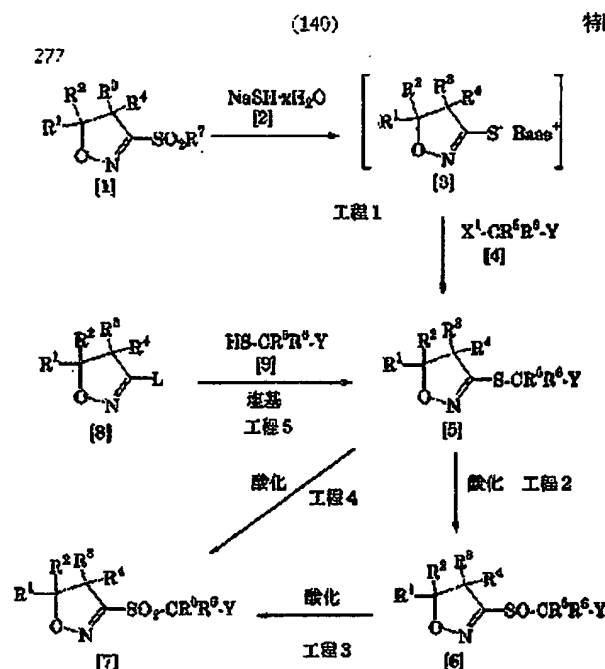
| R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | Y ¹ |
|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|----------------------------|
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | 7-Fluorobenzothiazol-2-yl |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | 4-Methylbenzothiazol-2-yl |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | 5-Methylbenzothiazol-2-yl |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | 6-Methylbenzothiazol-2-yl |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | 7-Methylbenzothiazol-2-yl |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | 4-Methoxybenzothiazol-2-yl |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | 5-Methoxybenzothiazol-2-yl |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | 6-Methoxybenzothiazol-2-yl |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | 7-Methoxybenzothiazol-2-yl |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | Quinolin-2-yl |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | Quinolin-6-yl |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | Quinoxalin-2-yl |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | Benzofuran-2-yl |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | 3-Chlorobenzofuran-2-yl |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | 4-Chlorobenzofuran-2-yl |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | 5-Chlorobenzofuran-2-yl |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | 6-Chlorobenzofuran-2-yl |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | 7-Chlorobenzofuran-2-yl |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | 3-Methylbenzofuran-2-yl |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | 4-Methylbenzofuran-2-yl |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | 5-Methylbenzofuran-2-yl |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | 6-Methylbenzofuran-2-yl |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | 7-Methylbenzofuran-2-yl |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | 3-Methoxybenzofuran-2-yl |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | 4-Methoxybenzofuran-2-yl |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | 5-Methoxybenzofuran-2-yl |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | 6-Methoxybenzofuran-2-yl |
| Me | Et | H | H | 2 | H | H | 7-Methoxybenzofuran-2-yl |

【0172】一般式【I】を有する本発明化合物は、以下に示す製造法に従って製造することができるが、これらの方法に限定されるものではない。

【0173】＜製造法1＞ 工程1～工程5

【0174】

【化3】



【0175】(式中、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶及びYは前記と同じ意味を表し、X¹はハロゲン原子を表し、R⁷はC1~C4アルキル基、置換されていてもよいフェニル基又は置換されていてもよいベンジル基を表し、Lはハロゲン原子、C1~C4アルキルスルホニル基、置換されていてもよいフェニルスルホニル基又は置換されていてもよいベンジルスルホニル基等の sulfonate 基を表し、xは1以上の整数を表す。)

以下、上記製造方法を各工程毎に詳説する。

【0176】(工程1)一般式(5)で表されるスルフィド誘導体は、一般式(1)で表される化合物と、一般式(2)で示される水酸化ナトリウム水和物を、溶媒中又は溶媒の非存在下で(好ましくは適当な溶媒中)、塩基の存在下反応させることにより一般式(3)で表されるメルカプタンの塩を反応系内で製造した後、メルカプタンの塩(3)を単離することなく一般式(4)で表されるハロゲン誘導体とを反応させること(場合によってはラジカル発生剤(例えばロソガリット(商品名): C₆H₅(OH)SO₂Na·2H₂O等)を添加することが

【0177】反応温度はいずれの反応も0℃から反応系における迴流温度までの任意の温度で行い、好ましくは10℃~100℃の温度範囲であり、反応は化合物により異なるが0.5時間~24時間で終了する。

【0178】反応に供される試剤の量は一般式(1)で表される化合物1当量に対して、一般式(2)で表される化合物又は一般式(4)で表される化合物は1~3当量、塩基を使用する場合は、塩基0.5~3当量である。

【0179】溶媒としては、例えばジオキサン、テトラヒドロフラン(THF)等のエーテル類、ジクロロエタン、四塩化炭素、クロロベンゼン又はジクロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、N,N-ジメチルアセトアミド、N,N-ジメチルホルムアミド又はN-メチル-2-ピロリジノン等のアミド類、ジメチルスルホキシド又はスルホラン等の硫黄化合物、ベンゼン、トルエン又はキシレン等の芳香族炭化水素類、メタノール、エタノール、プロパノール、イソプロパノール、ブタノール又はtert-ブタノール等のアルコール類、アセトン又は2-ブタノン等のケトン類、アセトニトリル等のニトリル類、水或いはこれらの混合物が挙げられる。

【0180】塩基としては、例えば水酸化ナトリウム等の金属水素化物、ナトリウムアミド又はリチウムジイソプロピルアミド等のアルカリ金属アミド類、ピリジン、トリエチルアミン又は1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]-7-ウンデセン等の有機塩基類、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属水素化物、水酸化カルシウム又は水酸化マグネシウム等のアルカリ土類金属水素化物、炭酸ナトリウム又は炭酸カリウム等のアルカリ金属炭酸塩、炭酸水素ナトリウム又は炭酸水素カリウム等のアルカリ金属重炭酸塩或いはナトリウムメトキシド又はカリウムtert-ブトキシド等の金属アルコラートが挙げられる。

【0181】(工程2)一般式(6)で表されるスルホキシド誘導体は、一般式(5)で表されるスルフィド誘導体と酸化剤とを、適当な溶媒中で反応させることにより製造することができる。

【0182】反応温度は0℃から反応系における迴流温

(141)

特開2002-308857

279

280

度までの任意の温度で行い、好ましくは0℃～60℃の温度範囲であり、反応は化合物により異なるが1時間～72時間で終了する。

【0183】反応に供される試剤の量は一般式〔5〕で表される化合物1当量に対して酸化剤は1～3当量である。

【0184】溶媒としては、例えばジクロロメタン、クロロホルム、ジクロロエタン、四塩化炭素、クロロベンゼン又はジクロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、ジオキサン、テトラヒドロフラン（THF）、ジメトキシエタン又はジエチルエーテル等のエーテル類、N,N-ジメチルアセトアミド、N,N-ジメチルホルムアミド又はN-メチル-2-ピロリジノン等のアミド類、メタノール、エタノール、プロパノール、イソプロパノール、ブタノール又はtert-ブタノール等のアルコール類、アセトン又は2-ブタノン等のケトン類、アセトニトリル等のニトリル類、酢酸、水或いはこれらの混合物が挙げられる。

【0185】酸化剤としては、例えば、m-クロロ過安息香酸、過キ酸又は過酢酸等の有機過酸化物、過酸化水素、過マンガン酸カリウム又は過ヨウ素酸ナトリウム等の無機過酸化物が挙げられる。

【0186】（工程3）一般式〔7〕で表されるスルホン誘導体は、一般式〔6〕で表されるスルホキシド誘導体と酸化剤とを、適当な溶媒中で反応させることにより製造することができる。

【0187】反応温度は0℃から反応系における還流温度までの任意の温度で行い、好ましくは0℃～60℃の温度範囲であり、反応は化合物により異なるが1時間～72時間で終了する。

【0188】反応に供される試剤の量は一般式〔6〕で表される化合物1当量に対して酸化剤は1～3当量である。

【0189】溶媒及び酸化剤としては、工程2と同様なものが挙げられる。

【0190】（工程4）一般式〔7〕で表されるスルホン誘導体は、適当な溶媒中、一般式〔5〕で表されるスルフィド誘導体と好適な酸化剤の量により一般式〔6〕で表されるスルホキシド誘導体を単離することなく製造することもできる。

【0191】反応温度は0℃から反応系における還流温度までの任意の温度で行い、好ましくは0℃～60℃の温度範囲であり、反応は化合物により異なるが1時間～72時間で終了する。

【0192】反応に供される試剤の量は一般式〔5〕で表される化合物1当量に対して酸化剤は1～3当量である。

【0193】溶媒及び酸化剤としては、工程2と同様な

ものが挙げられる。

【0194】（工程5）一般式〔5〕で示されるスルフィド誘導体は、一般式〔8〕で表される化合物と、一般式〔9〕で示されるメルカプタン誘導体とを、溶媒中又は溶媒の非存在下で（好ましくは適当な溶媒中）、塩基の存在下で反応させることにより製造することができる。

【0195】反応温度は0℃から反応系における還流温度までの任意の温度で行い、好ましくは10℃～100℃の温度範囲であり、反応は化合物により異なるが0.5時間～2.4時間で終了する。

【0196】反応に供される試剤の量は一般式〔8〕で表される化合物1当量に対して、一般式〔9〕で表される化合物は1～3当量、塩基は0.5～3当量である。

【0197】溶媒としては、例えばジエチルエーテル、ジメトキシエタン、ジオキサン又はテトラヒドロフラン（THF）等のエーテル類、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、ジクロロエタン、クロロベンゼン又はジクロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、N,N-ジメチルアセトアミド、N,N-ジメチルホルムアミド又はN-メチル-2-ピロリジノン等のアミド類、ジメチルスルホキシド又はスルホラン等の硫黄化合物、ベンゼン、トルエン又はキシレン等の芳香族炭化水素類、メタノール、エタノール、プロパノール、イソプロパノール、ブタノール又はtert-ブタノール等のアルコール類、アセトン又は2-ブタノン等のケトン類、アセトニトリル等のニトリル類、水或いはこれらの混合物が挙げられる。

【0198】塩基としては、例えば水素化ナトリウム等の金属水素化物、ナトリウムアミド又はリチウムジイソプロピルアミド等のアルカリ金属アミド、ピリジン、トリエチルアミン又は1,8-ジアザビシクロ〔5.4.0〕-7-ウンデセン等の有機塩基、水酸化ナトリウム又は水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物、水酸化カルシウム又は水酸化マグネシウム等のアルカリ土類金属水酸化物、炭酸ナトリウム又は炭酸カリウム等のアルカリ金属炭酸塩、炭酸水素ナトリウム又は炭酸水素カリウム等のアルカリ金属重炭酸塩或いはナトリウムメトキシド又はカリウムtert-ブトキシド等の金属アルコールが挙げられる。

【0199】一般式〔8〕で示される化合物のうちしがハロゲン原子で表される化合物〔12〕は工程6で示される方法により製造することができ、必要に応じ〔12〕と〔13〕を分離精製して化合物〔12〕を得る。

【0200】（工程6）

【0201】

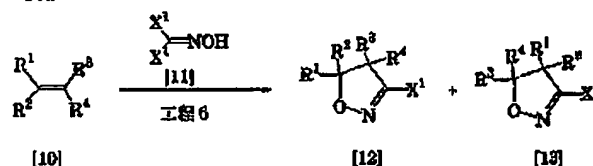
【化4】

(142)

特開2002-308857

281

282



【0202】(式中、 X^1 、 R^1 、 R^2 、 R^3 及び R^4 は前記と同じ意味を表す。)一般式【12】及び【13】で表されるイソオキサゾリン化合物は、一般式【10】で表されるオレフィン誘導体と、一般式【11】で示されるオキシム誘導体とを、溶媒中又は溶媒の非存在下で(好ましくは適当な溶媒中)、塩基の存在下で反応させることにより製造することができる。但し、 R^1 、 R^2 の両者が水素原子の場合には一般式【12】で表されるイソオキサゾリン化合物が優先的に得られる。

【0203】反応温度は0℃から反応系における過渡温度までの任意の温度で行い、好ましくは10℃～80℃の温度範囲であり、反応は化合物により異なるが0.5時間～2週間を終了する。

【0204】反応に供される試剤の量は一般式【11】で表される化合物1当量に対して、一般式【10】で表される化合物は1～3当量である。

【0205】溶媒としては、例えばエチレングリコールジメチルエーテル、エチレングリコールジエチルエーテル、ジエチルエーテル、ジオキサン又はテトラヒドロフラン等のエーテル類、ジクロロエタン、四塩化炭素、クロロベンゼン又はジクロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、ベンゼン、トルエン又はキシレン等の芳香族炭化水素類、酢酸エチル又は酢酸ブチル等の酢酸エステル類、水或いはこれらの混合物等が挙げられる。

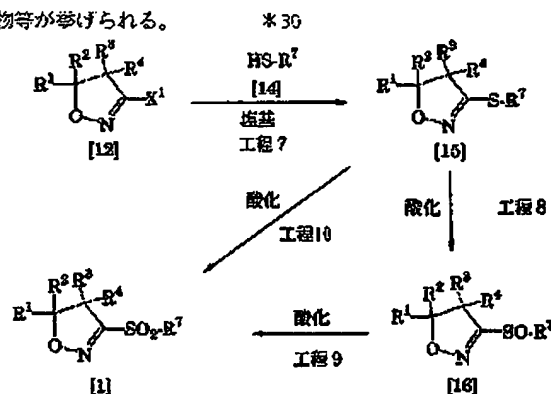
*【0206】塩基としては、例えば水酸化ナトリウム又は水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物、水酸化カルシウム又は水酸化マグネシウム等のアルカリ土類金属水酸化物、炭酸ナトリウム又は炭酸カリウム等のアルカリ金属炭酸塩、炭酸水素ナトリウム又は炭酸水素カリウム等のアルカリ金属重炭酸塩、酢酸ナトリウム又は酢酸カリウム等のアルカリ金属酢酸塩、フッ化ナトリウム又はフッ化カリウム等のアルカリ金属のフッ素化塩或いはピリジン、トリエチルアミン又は1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]-7-ウンデセン等の有機塩基等が挙げられる。

【0207】尚、上記製造方法で用いる製造中間体である一般式【10】で表される化合物は、市販のものを用いるか、又はウィッティヒ(Wittig)反応等の公知の反応により製造することができる。また、一般式【11】で示される化合物は、例えば、Liebig's Annalen der Chemie, 985 (1989)に記載の方法に従って製造することができる。

【0208】一般式【1】で表される化合物は、前記に示した一般式【12】で表される化合物から以下の方法により製造することができる。

【0209】

【化5】



【0210】(式中、 X^1 、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 及び R^7 は前記と同じ意味を表す。)

一般式【15】で表される化合物は前記記載の工程5、一般式【16】で表される化合物は前記記載の工程2、一般式【1】で表される化合物は化合物【15】から前記記載の工程4又は化合物【16】から工程3で示した方法に従って製造することができる。

【0211】溶媒、塩基及び酸化剤としては工程2、工

程3、工程4又は工程5で記載したものと同じものが挙げられる。

【0212】一般式【4】で表される化合物中、一般式【21】で表される化合物は、以下の方法により製造することができる。

【0213】

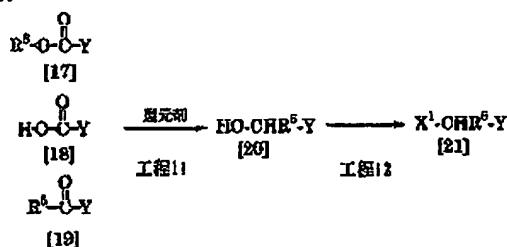
【化6】

(143)

特開2002-308857

283

284



【0214】（式中、 R^5 、 X^1 及び Y は前記と同じ意味を表し、 R^1 はアルキル基を表す。）

（工程11）一般式【20】で表される化合物は、化合物【17】、【18】又は【19】と還元剤とを溶媒中で反応することにより製造することができる。

【0215】この反応は通常、反応温度 $-60 \sim 150^\circ\text{C}$ で10分～24時間反応させる。

【0216】反応に供される試剤の量は、化合物【17】、【18】又は【19】1当量に対して、還元剤0.5～2当量が望ましいが、反応の状況に応じて任意に変化させることができる。

【0217】還元剤としては、【17】から【20】の製造では、例えば水素化ジイソブチルアルミニウム等の金属水素化物、或いは水素化ホウ素ナトリウム又は水素化リチウムアルミニウム等の金属水素錯化合物が、【18】又は【19】から【20】の製造では、例えば水素化ジイソブチルアルミニウム等の金属水素化物、水素化ホウ素ナトリウム又は水素化リチウムアルミニウム等の金属水素錯化合物、或いはジボランが挙げられる。

【0218】溶媒としては、例えばジエチルエーテル、テトラヒドロフラン又はジオキサン等のエーテル類、ベンゼン又はトルエン等の芳香族炭化水素類、メタノール又はエタノール等のアルコール類が挙げられる。

【0219】（工程12）一般式【21】で表される化合物は、化合物【20】とハロゲン化剤とを溶媒中で反応させることにより製造することができる。

【0220】この反応は通常、反応温度 $-50 \sim 100^\circ\text{C}$ で10分～24時間反応させる。

【0221】反応に供される試剤の量は化合物【20】1当量に対して、ハロゲン化剤1～3当量が望ましいが、反応の状況に応じて任意に変化させることができる。

【0222】ハロゲン化剤としては、例えば塩化水素、臭化水素、三塩化リン、三臭化リン又は塩化チオニル等が挙げられる。

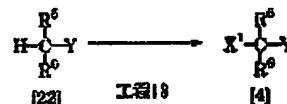
【0223】溶媒としては、例えばジクロロエタン又は四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、酢酸等の酸類或いはテトラヒドロフラン等のエーテル類が挙げられる。

【0224】一般式【4】で表される化合物は、以下の方法により製造することができる。

【0225】

【化7】

10



【0226】（式中、 R^5 、 R^6 、 X^1 及び Y は前記と同じ意味を表す。）

一般式【4】で表される化合物は、化合物【22】とハロゲン化剤とを溶媒中、触媒の存在下又は非存在下で反応させることにより製造することができる。

【0227】この反応は通常、反応温度 $30 \sim 150^\circ\text{C}$ で10分～24時間反応させる。

【0228】反応に供される試剤の量は化合物【22】1当量に対して、ハロゲン化剤1～10当量が望ましいが、反応の状況に応じて任意に変化させることができる。触媒は0.01～0.5当量である。

【0229】ハロゲン化剤としては、例えば臭素又は塩素等のハロゲン、 N -ブロモコハク酸イミド等の N -ハロコハク酸イミド、或いは過臭化ピリジニウム等のピリジン塩等が挙げられる。

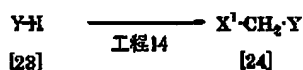
【0230】溶媒としては、例えばジクロロエタン、四塩化炭素、クロロベンゼン又はジクロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、 N 、 N -ジメチルアセトアミド、 N 、 N -ジメチルホルムアミド又は N -メチル-2-ピロリジノン等のアミド類、ジメチルスルホキシド又はスルホラン等の硫黄化合物、キ酸、又は酢酸等のカルボン酸類が挙げられる。

【0231】触媒としては、例えば過酸化ベンゾイル、 α 、 α -アゾビスイソブチロニトリル又はこれらの混合物が挙げられる。

【0232】一般式【4】で表される化合物中、一般式【24】で表される化合物は、以下の方法により製造することができる。

【0233】

【化8】



【0234】（式中、 X^1 及び Y は前記と同じ意味を表す。）

一般式【24】で表される化合物は、(Org.Synth., II, 557(1955))又は(J. Am. Chem. Soc., 72, 2216(1950))

に記載の方法に準じて、化合物【23】とハロゲン化水

(144)

特開2002-308857

285

素とホルムアルデヒド又はパラホルムアルデヒドとを溶媒中、ルイス酸存在下もしくは非存在下で反応させるか、或いは(J. Am. Chem. Soc., 97, 6155(1975))に記載の方法に従って、化合物[23]とハロゲンメチルエーテルとを溶媒中、ルイス酸存在下、反応させる方法により製造することができる。

【0235】この反応は通常、反応温度-40～150℃で10分～24時間反応させる。

【0236】反応に供される試剤の量は化合物[23]1当量に対して、ハロゲン化水素、ホルムアルデヒド、パラホルムアルデヒド、ルイス酸又はハロゲンメチルエーテル1～2当量が望ましいが、反応の状況に応じて任意に変化させることができる。

【0237】ルイス酸としては、例えば四塩化チタン、塩化亜鉛、塩化アルミニウム又は臭化亜鉛等が挙げられる。

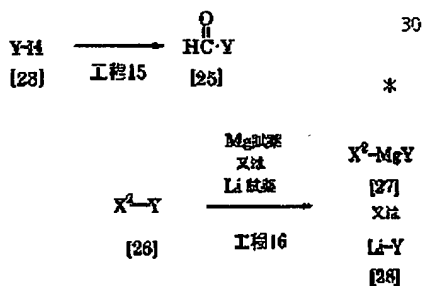
【0238】ハロゲン化水素としては、塩化水素、臭化水素又はヨウ化水素が挙げられる。

【0239】溶媒としては、例えばジクロロエタン、四塩化炭素又はクロロホルム等のハロゲン化炭化水素類、ヘキサン又はヘプタン等の脂肪族炭化水素類、ジオキサン又はテトラヒドロフラン等のエーテル類、酢酸等のカルボン酸類、二硫化炭素或いはそれらの混合物が挙げられる。

【0240】一般式[19]で表される化合物中、一般式[25]で表される化合物は、以下の方法により製造することができる。

【0241】

【化9】



【0249】(式中、R¹, R²及びYは前記と同じ意味を表し、X¹は塩素原子、臭素原子又はヨウ素原子を表す。)

一般式[17]、[18]、[19]又は[20]で表される化合物は、(J. Org. Chem., 65, 4618(2000))に記載方法に従って、化合物[26]とマグネシウム試薬とを溶媒中又は溶媒の非存在下、反応させて化合物[27]を得た後、求電子試薬と反応させるか、或いは(Synth. Commun., 24(2), 253(1994))に記載方法に従って、化合物[26]とn-ブチルリチウムとを溶媒中で反応させて化合物[28]を得た後、求電子試薬と反応させ

286

*【0242】(式中、Yは前記と同じ意味を表す。)

一般式[25]で表される化合物は、(Org. Synth., IV, 831(1963))に記載のビルスマイヤー(Vilsmeier)法に従って、化合物[23]とN,N-ジメチルホルムアミドとを塩化ホスホリル、ホスゲン又は塩化チオニル存在下、溶媒中又は溶媒の非存在下で反応させるか、或いは(Chem. Ber., 93, 88(1960))に記載の方法に従って、化合物[23]とジハロゲンメチルエーテルとを溶媒中、ルイス酸存在下、反応させた後、加水分解させる方法により製造することができる。

【0243】この反応は通常、反応温度-40～150℃で10分～24時間反応させる。

【0244】反応に供される試剤の量は化合物[23]1当量に対して、塩化ホスホリル、ホスゲン、塩化チオニル、N,N-ジメチルホルムアミド、ルイス酸又はジハロゲンメチルエーテル1～2当量が望ましいが、反応の状況に応じて任意に変化させることができる。

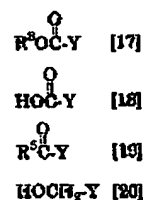
【0245】ルイス酸としては、例えば四塩化チタン、四塩化スズ、塩化亜鉛、塩化アルミニウム又は臭化亜鉛等が挙げられる。

【0246】溶媒としては、例えばジクロロエタン、四塩化炭素又はクロロホルム等のハロゲン化炭化水素類、ヘキサン又はヘプタン等の脂肪族炭化水素類、ジオキサン又はテトラヒドロフラン等のエーテル類、酢酸等のカルボン酸類、N,N-ジメチルホルムアミド等のアミド類、二硫化炭素或いはそれらの混合物が挙げられる。

【0247】一般式[17]、[18]、[19]及び[20]で表される化合物は、以下の方法により製造することができる。

【0248】

【化10】



る方法により製造することができる。

【0250】この反応は通常、反応温度-100～150℃で10分～24時間反応させる。

【0251】反応に供される試剤の量は化合物[26]1当量に対して、マグネシウム試薬又はリチウム試薬1～5当量、求電子試薬1～5当量が望ましいが、反応の状況に応じて任意に変化させることができる。

【0252】マグネシウム試薬としては、例えば金属マグネシウム、臭化イソプロピルマグネシウム又はジイソプロピルマグネシウム等が挙げられる。

【0253】リチウム試薬としては、例えばn-ブチル

(145)

特開2002-308857

287

リチウム、sec-ブチルリチウム又はtert-ブチルリチウム等が挙げられる。

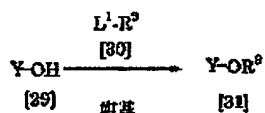
【0254】求電子試薬としては、例えば辛酸エチル、シアノ辛酸エチル又は酢酸エチル等のエステル類、アセチルクロリド又はクロロ酢酸メチル等の酸ハライド類、N,N-ジメチルホルムアミド等のアミド類、パラホルムアルデヒド等のアルデヒド類、或いは二酸化炭素が挙げられる。

【0255】溶媒としては、例えばジクロロエタン、四塩化炭素又はクロロホルム等のハロゲン化炭化水素類、ヘキサン又はペンタン等の脂肪族炭化水素類、ジオキサン又はテトラヒドロフラン等のエーテル類、或いはそれらの混合物が挙げられる。

【0256】一般式【31】で表される化合物は、以下の方法により製造することができる。

【0257】

【化11】



【0258】(式中、Yは前記と同じ意味を表し、R⁹はアルキル基、ハロアルキル基、シクロアルキル基、シクロアルキルアルキル基、アルコキシカルボニルアルキル基、置換されていてもよいベンジル基、置換されていてもよいヘテロ環アルキル基、アルケニル基、アルキニル基、アルキルスルホニル基、ハロアルキルスルホニル基、置換されていてもよい芳香族ヘテロ環基、置換されていてもよいフェニルスルホニル基、アシル基、ハロアルキルカルボニル基、置換されていてもよいベンジルカルボニル基又は置換されていてもよいベンゾイル基を表し、L¹はハロゲン原子、C1~C4アルキルスルホネート基、C1~C4アルキルスルホニル基、置換されていてもよいベンジルスルホニル基、置換されていてもよいフェニルスルホネート基又は置換されていてもよいベンジルスルホネート基等の脱離基を表す。但し、R⁹がハロアルキル基の場合は、L¹はハロアルキル化して残ったハロゲン原子より反応性の高い脱離基を表す。例えばC(H)F₂基の場合は塩素原子又は臭素原子を表し、C(H)C(F)₂基の場合は塩素原子、臭素原子、p-トルエンスルホニルオキシ基又はメチルスルホニルオキシ基等を表す。)

一般式【31】で表される化合物は、化合物【29】と化合物【30】とを溶媒中、塩基存在下で反応させることにより製造することができる。

【0259】この反応は通常、反応温度0~120℃で10分~24時間反応させる。

【0260】反応に供される試剤の量は化合物【29】1当量に対して化合物【30】は1~20当量、塩基は

288

1~3当量である。

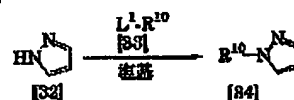
【0261】塩基としては、例えば炭酸ナトリウム又は炭酸カリウム等のアルカリ金属炭酸塩、水酸化ナトリウム又は水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物、水素化カリウム又は水素化ナトリウム等アルカリ金属水素化物、ナトリウムエトキシド又はナトリウムメトキシド等のアルカリ金属アルコラート、或いは1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]-7-ウンデセン等の有機塩基が挙げられる。

【0262】溶媒としては例えばシクロロメタン又はクロロホルム等のハロゲン化炭化水素類、ジエチルエーテル又はテトラヒドロフラン等のエーテル類、ベンゼン又はトルエン等の芳香族炭化水素類、ヘキサン又はヘプタン等の脂肪族炭化水素類、アセトン又はメチルイソブチルケトン等のケトン類、酢酸エチル又は酢酸メチル等のエステル類、N-メチルピロリドン又はN,N-ジメチルホルムアミド等のアミド類、ジメチルスルホキシド又はスルホラン等の硫黄化合物、アセトニトリル等のニトリル類、或いはそれらの混合物が挙げられる。

【0263】一般式【34】で表される化合物は、以下の方法により製造することができる。

【0264】

【化12】



【0265】(式中、L¹は前記と同じ意味を表し、R¹⁰はアルキル基、前記と同じ意味の置換基群より選択される任意の基でモノ置換されたアルキル基、ハロアルキル基、シクロアルキル基、アルケニル基、アルキニル基、アルキルスルフィニル基、アルキルスルホニル基、前記と同じ意味の置換基群より選択される任意の基でモノ置換されたアルキルスルホニル基、ハロアルキルスルホニル基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよい芳香族ヘテロ環基、置換されていてもよいフェニルスルホニル基、置換されていてもよい芳香族ヘテロスルホニル基、アシル基、ハロアルキルカルボニル基、置換されていてもよいベンジルカルボニル基、置換されていてもよいベンゾイル基、アルコキシカルボニル基、置換されていてもよいベンジロキシカルボニル基、置換されていてもよいフェノキシカルボニル基、カルバモイル基(該基の窒素原子は同一又は異なって、アルキル基又は置換されていてもよいフェニル基で置換されていてもよい)を表す。この場合、ピラゾール環の炭素原子は、前記と同じ意味の置換基群αより選択される。1~2個の同一又は相異なる基で置換されていてもよい。)

一般式【34】で表される化合物は、化合物【32】と化合物【33】とを溶媒中、塩基存在下で反応させるこ

とにより製造することができる。

【0266】この反応は通常、反応温度0～120℃で10分～24時間反応させる。反応に供される試剤の量は化合物【32】1当量に対して化合物【33】は1～20当量、塩基は1～3当量である。

【0267】塩基及び溶媒としては、例えば一般式【29】から一般式【31】の製造と同様なものが挙げられる。

【0268】Yがトリフルオロメチル基を導入する方法として、J.Chem. Soc. Perkin Trans.1,8, 2293-2299 (1990)、J.Fluorine Chem., 50(3), 411-426 (1990)、J.Chem.Soc. Chem. Commun., 18, 1389-1391 (1993)、J. Chem. Soc. Chem. Commun., 1, 53-54 (1992)、Chem. Lett., 1719-1720 (1981)、Chem. Pharm. Bull., 38 (9), 2446-2458 (1990)、J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1, 921-926 (1988)、Heterocycles, 37(2), 775-782 (1994)、Tetrahedron Lett., 30(16), 2133-2136 (1989)、J. Chem. Soc. Perkin Trans.1, 2755-2761 (1986)、Heterocycles, 22(1), 117-124 (1984)、Eur. J. Med. Chem. Chim. Ther., 24, 249-258 (1989)、Acta Chem. Scand. Ser. B, 38(6), 505-508 (1984)、J. Fluorine Chem., 21, 495-514 (1982)、J. Chem. Soc. Chem. Commun., 10, 638-639 (1988)、J. Fluorine Chem., 67(1), 5-6 (1994)、J. Heterocycl. Chem., 31(6), 1413-1416 (1994)、Chem. Heterocycl. Compd., 30(5), 576-578 (1994)、J. Fluorine Chem., 78(2), 177-182 (1996)、J. Heterocycl. Chem., 34(2), 551-556 (1997)、Tetrahedron, 55(52), 15067-15070 (1999)、Synthesis, 11, 932-933 (1980)に記載の方法又は導じた方法等が挙げられる

また、一般式【4】、【17】、【18】、【19】、【20】、【21】、【22】、【23】、【24】、【25】、【26】、【29】及び【31】は、Yがフリル基の場合は(Methoden der Organischen Chemie, E6a, 16-185 (1994))、Yがチエニル基の場合は(Methoden der Organischen Chemie, E6a, 186-555 (1994))、Yがピロリル基の場合は(Methoden der Organischen Chemie, E6a, 556-798 (1994))、Yがピラゾリル基の場合は(Methoden der Organischen Chemie, E8b, 399-763 (1994))、特開平2000-219679号公報明細書、Yがイソキサゾリル基の場合は(Methoden der Organischen Chemie, E8a, 45-225 (1993))、Yがイソチアゾリル基の場合は(Methoden der Organischen Chemie, E8a, 568-798 (1993))、Yがオキサゾリル基の場合は(Methoden der Organischen Chemie, E8a, 891-1019 (1993))、Yがチアゾリル基の場合は(Methoden der Organischen Chemie, E8b, 1-398 (1994))、Yがイミダゾリル基の場合は(Methoden der Organischen Chemie, E8c, 1-215 (1994))、Yがピリジリル基の場合は(Methoden der Organischen Chemie, E7a, 286-686 (1992))、Yがピリダジニル基の場合は(Methoden der Organischen Chemie, E9a, 557-682 (1997))、Yがピリミジニル基の場合は(Methoden der Organischen Chemie, E9b, 1, 1-249 (1998))、Yがピラジニル基の場合は(Methoden der Organischen Chemie, E9b, 1, 250-372 (1998))、Yがトリアジニル基の場合は(Methoden der Organischen Chemie, E9c, 530-796 (1998))、Yがトリアゾリル基の場合は(Methoden der Organischen Chemie, E8d, 305-405, 479-598 (1994))、Yがオキサジアゾリル基の場合は(Methoden der Organischen Chemie, E8c, 397-818 (1994))、Yがチアジアゾリル基の場合は(Methoden der Organischen Chemie, E8d, 59-304 (1994))、Yがベンゾフリル基の場合は(Methoden der Organischen Chemie, E6b1, 33-216 (1994))、国際特許出願公開公報WO-1997/29105号明細書、Yがベンゾチエニル基の場合は(Methoden der Organischen Chemie, E6b1, 217-322 (1994))、Yがインドリル基の場合は(Methoden der Organischen Chemie, E6b1, 546-848 (1994))、(Methoden der Organischen Chemie, E6b2, 849-1336 (1994))、国際特許出願公開公報WO-1997/42188-A1号明細書、Yがベンゾオキサゾリル基の場合は(Methoden der Organischen Chemie, E8a, 1020-1194 (1993))、Yがベンゾチアゾリル基の場合は(Methoden der Organischen Chemie, E8b, 865-1062 (1994))、Yがベンゾイミダゾリル基の場合は(Methoden der Organischen Chemie, E8c, 216-391 (1994))、Yがベンゾイソキサゾリル基の場合は(Methoden der Organischen Chemie, E8a, 226-348 (1993))、Yがベンゾイソチアゾリル基の場合は(Methoden der Organischen Chemie, E8a, 799-852 (1993))、Yがインダゾリル基の場合は(Methoden der Organischen Chemie, E8b, 764-864 (1994))、Yがキノリル基の場合は(Methoden der Organischen Chemie, E7a, 290-570 (1991))、Yがイソキノリル基の場合は(Methoden der Organischen Chemie, E7a, 571-758 (1991))、Yがフサラジニル基の場合は(Methoden der Organischen Chemie, E9a, 744-789 (1997))、Yがキノキサリニル基の場合は(Methoden der Organischen Chemie, E9b, 2, 93-265 (1998))、Yがキナゾリニル基の場合は(Methoden der Organischen Chemie, E9b, 2, 1-192 (1998))、Yがシンノリニル基の場合は(Methoden der Organischen Chemie, E9a, 683-743 (1997))又はYがベンゾトリアゾリル基の場合は(Methoden der Organischen Chemie, E8d, 406-478 (1994))に記載の方法又は導じた方法等で製造することができる。

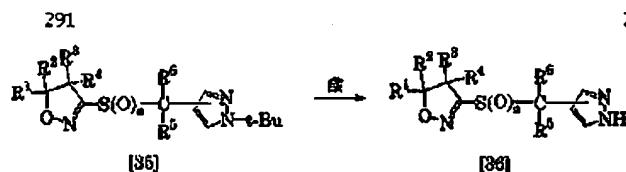
【0269】<製造法2>

【0270】

【化13】

(147)

特開2002-308857



【0271】(式中、 R^1 、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 及び R^5 は前記と同じ意味を表す。この場合、ピラゾール環の炭素原子は、前記と同じ意味の置換基群 α より選択される。1~2個の同一又は相異なる基で置換されていてもよい。)

一般式【36】で表される本発明化合物は、製造法1により製造することができる本発明化合物【35】と酸とを溶媒中で反応させることにより製造することができる。

【0272】この反応は通常、反応温度0~120℃で10分~24時間反応させる。

【0273】反応に供される試剤の量は化合物【35】

1当量に対して、酸1~10当量が望ましいが、反応の*

*状況に応じて任意に変化させることができる。

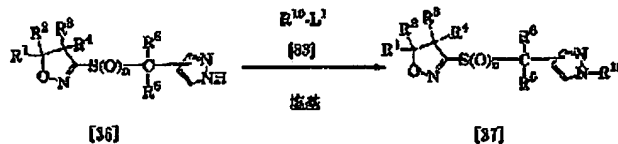
【0274】酸としては、例えば塩酸、臭化水素酸、トリフルオロ酢酸等が挙げられる。

【0275】溶媒としては、例えばジクロロエタン、四塩化炭素、クロロベンゼン又はジクロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、N,N-ジメチルアセトアミド、N,N-ジメチルホルムアミド又はN-メチル-2-ピロリジノン等のアミド類、ジメチルスルホキシド又はスルホラン等の硫黄化合物、辛酸又は酢酸等のカルボン酸類或いは水が挙げられる。

【0276】<製造法3>

【0277】

【化14】



【0278】(式中、 n 、 L^1 、 R^1 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 及び R^8 は前記と同じ意味を表す。この場合、ピラゾール環の炭素原子は、前記と同じ意味の置換基群 α より選択される。1~2個の同一又は相異なる基で置換されていてもよい。)

一般式【37】で表される本発明化合物は、本発明化合物【36】と一般式【33】で表される化合物とを溶媒中、塩基存在下、反応させることにより製造することができる。

【0279】反応に供される試剤の量は一般式【36】で表される化合物1当量に対して、一般式【33】で表される化合物は1~3当量であり、塩基は、1~3当量である。

【0280】溶媒としては、例えばジオキサン又はテトラヒドロフラン(THF)等のエーテル類、ジクロロエタン、四塩化炭素、クロロベンゼン又はジクロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、N,N-ジメチルアセトアミド、N,N-ジメチルホルムアミド又はN-メチル-2-ピロリジノン等のアミド類、ジメチルスルホキシド又はスルホラン等の硫黄化合物、ベンゼン、トルエン

又はキシレン等の芳香族炭化水素類、メタノール、エタノール、プロパノール、イソプロパノール、ブタノール又はtert-ブタノール等のアルコール類、アセトン又は2-ブタノン等のケトン類、アセトニトリル等のニトリル類、水或いはこれらの混合物が挙げられる。

【0281】塩基としては、例えば水素化ナトリウム等の金属水素化物、ナトリウムアミド又はリチウムジイソプロピルアミド等のアルカリ金属アミド類、ピリジン、トリエチルアミン又は1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]-7-ウンデセン等の有機塩基類、水酸化ナトリウム又は水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物、水酸化カルシウム又は水酸化マグネシウム等のアルカリ土類金属水酸化物、炭酸ナトリウム又は炭酸カリウム等のアルカリ金属炭酸塩類、炭酸水素ナトリウム又は炭酸水素カリウム等のアルカリ金属重炭酸塩、或いはナトリウムメトキシド又はカリウムtert-ブトキシド等の金属アルコラート等が挙げられる。

【0282】<製造法4>

【0283】

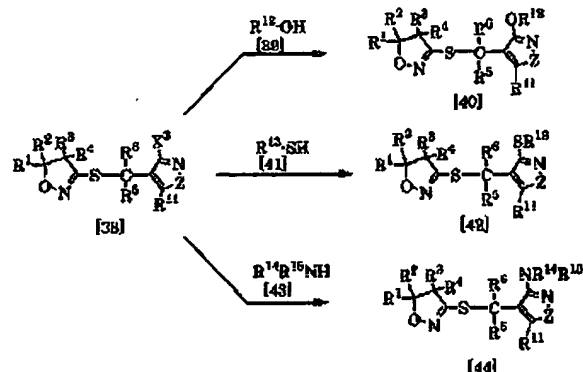
【化15】

特開2002-308857

293

(148)

294



【0284】(式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 及び R^6 は前記と同じ意味を表し、 R^{11} はトリフルオロメチル基、ジフルオロメチル基又はジフルオロメトキシ基を表し、 X^3 は塩素原子又はフッ素原子を表し、 R^{11} はアルキル基、ハロアルキル基、シクロアルキル基、シクロアルキルアルキル基、アルケニル基、アルキニル基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよい芳香族ヘテロ環基、アルコキシカルボニルアルキル基、置換されていてもよいヘテロ環アルキル基、又は置換されていてもよいベンジル基を表し、 R^{12} はアルキル基、ハロアルキル基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよい芳香族ヘテロ環基、アルコキシカルボニルアルキル基又は置換されていてもよいベンジル基を表し、 R^{13} 及び R^{14} は同一又は異なって、水素原子、アルキル基、置換されていてもよいフェニル基、アシル基、ハロアルキルカルボニル基、置換されていてもよいベンジルカルボニル基、置換されていてもよいベンゾイル基、アルキルスルホニル基、ハロアルキルスルホニル基、置換されていてもよいベンジルスルホニル基又は置換されていてもよいフェニルスルホニル基を表し、 Z は酸素原子、イオウ原子又は $N-R^{10}$ を表し、 R^{10} は水素原子又は前記と同じ意味の R^{10} を表す。)

一般式[40]、一般式[42]又は一般式[44]で表される本発明化合物は、一般式[38]で表される本発明化合物とそれぞれ化合物[39]、化合物[41]又は化合物[43]とを無溶媒又は溶媒中、必要に応じ*

*塩基存在下、反応させることにより製造することができる。

【0285】この反応は通常、反応温度 $20\sim 200^\circ C$ 、好ましくは $30\sim 180^\circ C$ で10分～48時間、必要に応じ加圧下で反応させる。

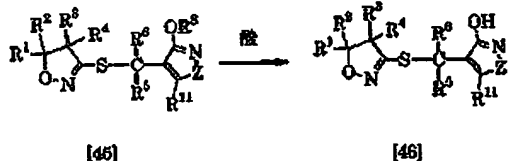
【0286】反応に供される試剤の量は化合物[38]1当量に対して、化合物[39]、化合物[41]又は化合物[43]は1～20当量である。必要に応じて使用される塩基としては、例えば炭酸カリウム又は水酸化ナトリウム等のアルカリ金属水酸化物、水素化カリウム又は水素化ナトリウム等アルカリ金属水素化物、ナトリウムエトキシド又はナトリウムメトキシド等のアルカリ金属アルコラート、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]-7-ウンデセン等の有機塩基が挙げられる。

【0287】溶媒としては例えばクロロホルム等のハロゲン化炭化水素類、ジエチルエーテル又はテトラヒドロフラン等のエーテル類、ベンゼン又はトルエン等の芳香族炭化水素類、ヘキサン又はヘプタン等の脂肪族炭化水素類、アセトン又はメチルイソブチルケトン等のケトン類、酢酸エチル等のエステル類、 N -メチルピロリドン又は N,N -ジメチルホルムアミド等のアミド類、ジメチルスルホキシド又はスルホラン等の硫黄化合物、アセトニトリル或いはそれらの混合物が挙げられる。

【0288】<製造法5>

【0289】

【化16】



【0290】(式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^{11} 及び Z は前記と同じ意味を表す。)

一般式[46]で表される本発明化合物は、本発明化合物[45]と酸とを溶媒中で反応させることにより製造することができる。

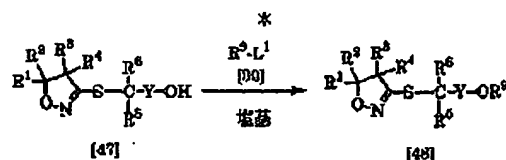
【0291】この反応は通常、反応温度 $0\sim 120^\circ C$ で

10分～24時間反応させる。反応に供される試剤の量は化合物[45]1当量に対して、酸1～10当量が望ましいが、反応の状況に応じて任意に変化させることができる。

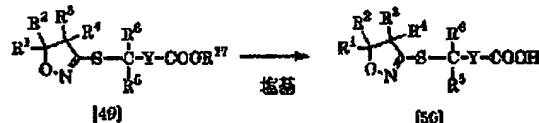
【0292】酸及び溶媒としては、製造法2と同様なのが挙げられる。

296

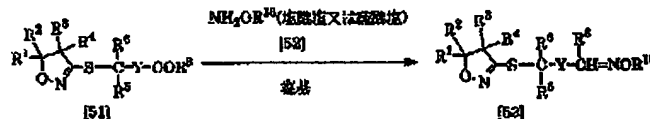
*【化17】



【化18】



【化19】



【0308】塩基としては、例えば炭酸カリウム又は炭酸ナトリウム等の金属炭酸塩類、酢酸カリウム又は酢酸ナトリウム等の金属酢酸塩類、トリエチルアミン、ジメチルアミン又は1, 8-ジアザビシクロ[5.4.0]-

(150)

特開2002-308857

297

298

7-ウンデセン等の有機塩基が挙げられる。

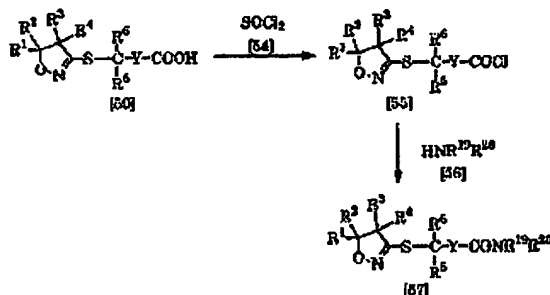
* 或いはそれらの混合物が挙げられる。

【0309】溶媒としては、例えばメタノール、エタノール等のアルコール類、テトラヒドロフラン等のエーテル類、N,N-ジメチルホルムアミド等のアミド類、水 *

【0310】<製造法9>

【0311】

【化20】



【0312】(式中、Y、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵及びR⁶は前記と同じ意味を表す。R¹⁹及びR²⁰は、各々、水素原子又はアルキル基を表す。この場合、Yは前記と同じ意味の置換基群αより選択される、1～5個までの同一又は異なる基で置換されていてもよい。) 一般式【57】で表される本発明化合物は、本発明化合物【50】と塩化チオニル【54】とを溶媒中又は無溶媒中で反応させて化合物【55】を製造した後、化合物【55】と化合物【56】とを溶媒中又は無溶媒中、反応させることにより製造することができる。

【0313】【50】から【55】の反応は、通常、反応温度0～100℃で10分～24時間反応させる。

【0314】反応に供される試剤の量は化合物【50】1当量に対して、塩化チオニル【54】1～100当量が望ましいが、反応の状況に応じて任意に変化させること※30

※とができる。溶媒としては例えばジクロロメタン又はクロロホルム等のハロゲン化炭化水素類、ジエチルエーテル又はテトラヒドロフラン等のエーテル類、ベンゼン又はトルエン等の芳香族炭化水素類が挙げられる。

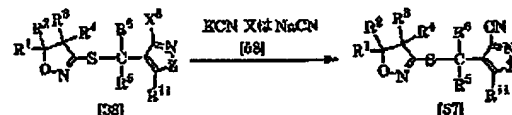
20 【0315】【55】から【57】の反応は、通常、反応温度0～100℃で10分～24時間反応させる。

【0316】反応に供される試剤の量は化合物【55】1当量に対して、化合物【56】1～100当量が望ましいが、反応の状況に応じて任意に変化させることができる。溶媒としては例えば【50】から【55】の反応と同様なものが挙げられる。

【0317】<製造法10>

【0318】

【化21】



【0319】(式中、Z、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R¹¹及びX'は前記と同じ意味を表す。)

一般式【59】で表される本発明化合物は、本発明化合物【38】と化合物【58】とを溶媒中で反応させることにより製造することができる。

【0320】この反応は通常、反応温度0～100℃で10分～24時間反応させる。

【0321】反応に供される試剤の量は化合物【38】1当量に対して、化合物【58】1～2当量が望ましいが、反応の状況に応じて任意に変化させることができる。溶媒としては、例えばジオキサン又はテトラヒド

ロフラン(THF)等のエーテル類、ジクロロエタン、四塩化炭素、クロロベンゼン又はジクロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、N,N-ジメチルアセトアミド、N,N-ジメチルホルムアミド又はN-メチル-2-ピロリジノン等のアミド類、ジメチルスルホキシド又はスルホラン等の硫黄化合物、アセトン又は2-ブタン等のケトン類、アセトニトリル等のニトリル類、水或いはこれらの混合物が挙げられる。

【0322】<製造法11>

【0323】

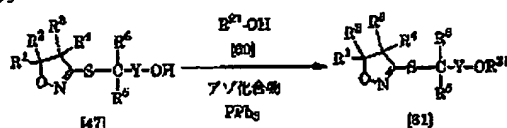
【化22】

(151)

特開2002-308857

299

300



【0324】(式中、Y、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵及びR⁶は前記と同じ意味を表し、R¹¹はアルキル基、ハロアルキル基、シクロアルキル基、シクロアルキルアルキル基、アルケニル基、アルキニル基、アルコキシカルボニルアルキル基、置換されていてもよいヘテロアルキル基、又は置換されていてもよいベンジル基を表す。この場合、Yは前記と同じ意味の置換基群αより選択される、1～5個までの同一又は相異なる基で置換されていてもよい。)

一般式【61】で表される本発明化合物は、本発明化合物【47】と化合物【60】とをアゾ化合物とトリフェニルホスフィンの存在下、溶媒中で反応させる公知の方法(Synthesis, 1-28(1981))に進じて製造することができる。

【0325】この反応は通常、反応温度0～100℃で10分～24時間反応させる。

【0326】反応に供される試剤の量は化合物【47】

1当量に対して、化合物【60】1～1.5当量、アゾ*

*化合物1～1.5当量、トリフェニルホスフィン1～1.5当量が望ましいが、反応の状況に応じて任意に変化させることができる。

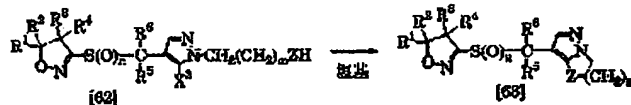
【0327】溶媒としては、例えばジオキサン又はテトラヒドロフラン(THF)等のエーテル類、ジクロロエタン、四塩化炭素、クロロベンゼン又はジクロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、N,N-ジメチルアセトアミド、N,N-ジメチルホルムアミド又はN-メチル-2-ピロリジノン等のアミド類、ジメチルスルホキシド又はスルホラン等の硫黄化合物、ベンゼン、トルエン又はキシレン等の芳香族炭化水素類、アセトニトリル或いはこれらの混合物等が挙げられる。

【0328】アゾ化合物としては、例えばアゾジカルボン酸ジエチル又はアゾジカルボン酸ジイソプロピル等が挙げられる。

【0329】<製造法12>

【0330】

【化23】



【0331】(式中、X¹、n、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶及びZは前記と同じ意味を表し、mは1～4の整数を表す。この場合、ピラゾール環の3位の炭素原子は、前記と同じ意味の置換基群αより選択される基で置換されていてもよい。)

一般式【63】で表される本発明化合物は、本発明化合物【62】を塩基存在下溶媒中で反応させることにより製造することができる。

【0332】この反応は通常、反応温度0～120℃で10分～24時間反応させる。

【0333】反応に供される試剤の量は一般式【62】で表される化合物1当量に対して、塩基1～3当量が望ましいが、反応の状況に応じて任意に変化させることができる。

【0334】塩基及び溶媒としては、製造法3と同様なものが挙げられる。

【0335】尚、製造法2及び製造法4～12記載のスルフィド化合物は、製造法1記載の方法で酸化することによりスルホキシド体及びスルホン化合物を製造することができる。

【0336】

【実施例】次に、実施例をあげて本発明化合物の製造法、製剤法及び用途を具体的に説明する。尚、本発明化

合物の製造中間体の製造法も併せて記載する。

【0337】<実施例1>

3-(5-クロロ-1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5,5-ジメチル-2-イソキサゾリン(本発明化合物番号3-0001)の製造

3-メチルスルホニル-5,5-ジメチル-2-イソキサゾリン2.3g(13.1ミリモル)のN,N-ジメチルホルムアミド20ml溶液に、水酸化ナトリウム水和物2.1g(純度70%、26.2ミリモル)を加え2時間攪拌した。その後、無水炭酸カリウム1.8g(13.1ミリモル)、ロンガリット2.0g(13.1ミリモル)及び4-ブロモメチル-5-クロロ-1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール3.6g(10.5ミリモル)を加え、さらに室温で15時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒：ヘキサン-酢酸エチル混合溶媒)で精製し、白色結晶(融点89～90℃)の3-(5-クロロ-1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5,5-ジメチル-2-イソキサゾリン2.

(152)

特開2002-308857

301

7 g (収率65.5%)を得た。

¹H-NMR(CDCl₃/TMS, δ(ppm)): 7.55-7.50(5H, m), 4.33(2H, s), 2.83(2H, s), 1.45(6H, s)

【0338】<実施例2>

3-(5-クロロ-1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルスルホニル)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン(本発明化合物番号3-0002)の製造

3-(5-クロロ-1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン0.4 g(1.0ミリモル)のクロロホルム15 ml溶液に、氷冷下、m-クロロ過安息香酸0.63 g(純度70%, 2.6ミリモル)を加え、室温で2時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム水溶液及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、析出した結晶をヘキサンで洗浄し、白色結晶(融点132~133℃)の3-(5-クロロ-1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルスルホニル)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン0.4 g(収率83.2%)を得た。

¹H-NMR(CDCl₃/TMS, δ(ppm)): 7.60-7.51(5H, m), 4.73(2H, s), 3.14(2H, s), 1.53(6H, s)

【0339】<実施例3>

3-(5-クロロ-1-メチル-3-フェニル-1H-ピラゾール-4-イルメチルスルフィニル)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン(本発明化合物番号3-0003)の製造

3-(5-クロロ-1-メチル-3-フェニル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン0.85 g(2.53ミリモル)のクロロホルム30 ml溶液に、氷冷下、m-クロロ過安息香酸0.87 g(純度70%, 3.54ミリモル)を加え、室温で1時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム水溶液及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサン-酢酸エチル混合溶媒)で精製し、透明アゼ状物質の3-(5-クロロ-1-メチル-3-フェニル-1H-ピラゾール-4-イルメチルスルフィニル)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン0.48 g(収率53.9%)を得た。

¹H-NMR(CDCl₃/TMS, δ(ppm)): 7.63-7.60(2H, m), 7.48-7.37(3H, m), 4.29(2H, q), 3.91(3H, s), 3.12(1H, d), 2.79(1H, d), 1.41(3H, s), 1.35(3H, s)

【0340】<実施例4>

5,5-ジメチル-3-(5-フルオロ-1-フェニル-

302

3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-2-イソオキサゾリン(本発明化合物番号3-0021)の製造

5,5-ジメチル-3-メチルスルホニル-2-イソオキサゾリン(本発明化合物番号2-1)18.7 g(105.7ミリモル)のN,N-ジメチルホルムアミド300 ml溶液に、水酸化ナトリウム水和物9.3 g(純度70%, 116.3ミリモル)を加え2時間攪拌した。反応系を氷冷し、4-ブロモメチル-5-フルオロ-1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール30.3 g(93.8ミリモル)のN,N-ジメチルホルムアミド200 ml溶液を加え、さらに0℃で30分間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサン-酢酸エチル混合溶媒)で精製し、黄色結晶物質の5,5-ジメチル-3-(5-フルオロ-1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-2-イソオキサゾリン13.11 g(収率37.4%)を得た。

¹H-NMR値(CDCl₃/TMS, δ(ppm)): 7.65-7.39(5H, m), 4.24(2H, s), 2.81(2H, s), 1.43(6H, s)

【0341】<実施例5>

5,5-ジメチル-3-(5-エチルチオ-1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-2-イソオキサゾリン(本発明化合物番号3-0022)の製造

エタンチオール0.25 g(4.0ミリモル)のN,N-ジメチルホルムアミド10 ml溶液に、水酸化ナトリウム0.2 g(4.0ミリモル)、水1 mlを加え、室温で30分間攪拌した。5,5-ジメチル-3-(5-フルオロ-1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-2-イソオキサゾリン0.5 g(1.4ミリモル)のN,N-ジメチルホルムアミド5 ml溶液を加え、さらに1時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、5,5-ジメチル-3-(5-エチルチオ-1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-2-イソオキサゾリン0.6 g(収率100%)を得た。

¹H-NMR値(CDCl₃/TMS, δ(ppm)): 7.62-7.47(5H, m), 4.44(2H, s), 2.83(2H, s), 2.50(2H, q), 1.45(6H, s), 1.02(3H, t)

【0342】<実施例6>

5,5-ジメチル-3-(5-エチルスルホニル-1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルスルホニル)-2-イソオキサゾリン

(153)

特開2002-308857

303

(本発明化合物番号3-0004)の製造

5,5-ジメチル-3-(5-エチルチオ-1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-2-イソキサゾリン0.6g(1.3ミリモル)のクロロホルム10ml溶液に、氷冷下、m-クロロ過安息香酸1.7g(純度70%, 6.7ミリモル)を加え、室温で16時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム水溶液及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、析出した結晶をヘキサンで洗浄し、淡黄色結晶(融点158~160℃)の5,5-ジメチル-3-(5-エチルスルホニル-1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルスルホニル)-2-イソキサゾリン0.6g(収率93.0%)を得た。

(¹H-NMR値(CDCl₃/TMS δ(ppm)): 7.58-7.54(5H, m), 5.16(2H, s), 3.18(2H, s), 3.15(2H, q), 1.55(6H, s), 1.24(3H, t)

【0343】<実施例7>

5,5-ジメチル-3-(5-ジメチルアミノ-1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-2-イソキサゾリン(本発明化合物番号3-0023)の製造

5,5-ジメチル-3-(5-フルオロ-1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-2-イソキサゾリン0.5g(1.3ミリモル)のN,N-ジメチルホルムアミド10ml溶液に、ジメチルアミン40%水溶液0.8g(6.7ミリモル)を加え、封管で100℃で9時間攪拌した。ジメチルアミン40%水溶液3.0g(26.6ミリモル)を加え、さらに9時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサン-酢酸エチル混合溶媒)で精製し、5,5-ジメチル-3-(5-ジメチルアミノ-1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-2-イソキサゾリン0.4g(収率80.6%)を得た。

(¹H-NMR値(CDCl₃/TMS δ(ppm)): 7.58-7.38(5H, m), 4.35(2H, s), 2.82(2H, s), 2.77(6H, s), 1.45(6H, s)

【0344】<実施例8>

5,5-ジメチル-3-(5-ジメチルアミノ-1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルスルホニル)-2-イソキサゾリン(本発明化合物番号3-0005)の製造

5,5-ジメチル-3-(5-ジメチルアミノ-1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-

304

-イルメチルチオ)-2-イソキサゾリン0.4g(1.1ミリモル)のクロロホルム10ml溶液に、氷冷下、m-クロロ過安息香酸0.7g(純度70%, 2.7ミリモル)を加え、室温で20時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム水溶液及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、析出した結晶をヘキサンで洗浄し、白色粉末(融点150~151℃)の5,5-ジメチル-3-(5-ジメチルアミノ-1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルスルホニル)-2-イソキサゾリン0.2g(収率52.0%)を得た。

(¹H-NMR値(CDCl₃/TMS δ(ppm)): 7.61-7.38(5H, m), 4.75(2H, s), 3.13(2H, s), 2.76(6H, s), 1.53(6H, s)

【0345】<実施例9>

3-(1-tert-ブチル-5-クロロ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5,5-ジメチル-2-イソキサゾリン(本発明化合物番号3-0006)の製造

5,5-ジメチル-3-メチルスルホニル-2-イソキサゾリン24.1g(136.0ミリモル)のN,N-ジメチルホルムアミド200ml溶液に、水酸化ナトリウム21.8g(純度70%, 272.5ミリモル)を加え1時間攪拌した。その後、無水炭酸カリウム18.8g(136.2ミリモル)、ロンガリット21.0g(136.2ミリモル)を加え、更に2時間攪拌後、4-ブロモメチル-1-tert-ブチル-5-クロロ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール40g(125ミリモル)を氷冷下加えた。その後、室温で2時間攪拌し、反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水および食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサン-酢酸エチル混合溶媒)で精製し、淡桃色結晶(融点79.0~81.0℃)の3-(1-tert-ブチル-5-クロロ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5,5-ジメチル-2-イソキサゾリン23.0g(収率57.1%)を得た。

(¹H-NMR値(CDCl₃/TMS δ(ppm)): 4.24(2H, s), 2.80(2H, s), 1.71(9H, s), 1.43(6H, s)

【0346】<実施例10>

3-(5-クロロ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5,5-ジメチル-2-イソキサゾリン(本発明化合物番号3-0007)の製造

3-(1-tert-ブチル-5-クロロ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5,5-ジメチル-2-イソキサゾリン19.8g(53.4

(153)

特開2002-308857

303

(本発明化合物番号3-0004)の製造

5,5-ジメチル-3-(5-エチルチオ-1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-2-イソオキサゾリン0.6g(1.3ミリモル)のクロロホルム10ml溶液に、氷冷下、m-クロロ過安息香酸1.7g(純度70%, 6.7ミリモル)を加え、室温で16時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム水溶液及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、析出した結晶をヘキサンで洗浄し、淡黄色結晶(融点158~160℃)の5,5-ジメチル-3-(5-エチルスルホニル-1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルスルホニル)-2-イソオキサゾリン0.6g(収率93.0%)を得た。

(¹H-NMR値(CDC₃H₇/TMS δ(ppm)): 7.58-7.54(5H, m), 5.16(2H, s), 3.18(2H, s), 3.15(2H, q), 1.55(6H, s), 1.24(3H, t)

【0343】<実施例7>

5,5-ジメチル-3-(5-ジメチルアミノ-1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-2-イソオキサゾリン(本発明化合物番号3-0023)の製造

5,5-ジメチル-3-(5-フルオロ-1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-2-イソオキサゾリン0.5g(1.3ミリモル)のN,N-ジメチルホルムアミド10ml溶液に、ジメチルアミン40%水溶液0.8g(6.7ミリモル)を加え、封管で100℃で9時間攪拌した。ジメチルアミン40%水溶液3.0g(26.6ミリモル)を加え、さらに9時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサン-酢酸エチル混合溶媒)で精製し、5,5-ジメチル-3-(5-ジメチルアミノ-1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-2-イソオキサゾリン0.4g(収率80.6%)を得た。

(¹H-NMR値(CDC₃H₇/TMS δ(ppm)): 7.58-7.38(5H, m), 4.35(2H, s), 2.82(2H, s), 2.77(6H, s), 1.45(6H, s)

【0344】<実施例8>

5,5-ジメチル-3-(5-ジメチルアミノ-1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルスルホニル)-2-イソオキサゾリン(本発明化合物番号3-0005)の製造

5,5-ジメチル-3-(5-ジメチルアミノ-1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4

304

-イルメチルチオ)-2-イソオキサゾリン0.4g(1.1ミリモル)のクロロホルム10ml溶液に、氷冷下、m-クロロ過安息香酸0.7g(純度70%, 2.7ミリモル)を加え、室温で20時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム水溶液及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、析出した結晶をヘキサンで洗浄し、白色粉末(融点150~151℃)の5,5-ジメチル-3-(5-ジメチルアミノ-1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルスルホニル)-2-イソオキサゾリン0.2g(収率52.0%)を得た。

(¹H-NMR値(CDC₃H₇/TMS δ(ppm)): 7.61-7.38(5H, m), 4.75(2H, s), 3.13(2H, s), 2.76(6H, s), 1.53(6H, s)

【0345】<実施例9>

3-(1-tert-ブチル-5-クロロ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン(本発明化合物番号3-0006)の製造

5,5-ジメチル-3-メチルスルホニル-2-イソオキサゾリン24.1g(136.0ミリモル)のN,N-ジメチルホルムアミド200ml溶液に、水酸化ナトリウム21.8g(純度70%, 272.5ミリモル)を加え1時間攪拌した。その後、無水炭酸カリウム18.8g(136.2ミリモル)、ロンガリット21.0g(136.2ミリモル)を加え、更に2時間攪拌後、4-ブロモメチル-1-tert-ブチル-5-クロロ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール40g(125ミリモル)を氷冷下加えた。その後、室温で2時間攪拌し、反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水および食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサン-酢酸エチル混合溶媒)で精製し、淡桃色結晶(融点79.0~81.0℃)の3-(1-tert-ブチル-5-クロロ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン23.0g(収率57.1%)を得た。

(¹H-NMR値(CDC₃H₇/TMS δ(ppm)): 4.24(2H, s), 2.80(2H, s), 1.71(9H, s), 1.43(6H, s)

【0346】<実施例10>

3-(5-クロロ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン(本発明化合物番号3-0007)の製造

3-(1-tert-ブチル-5-クロロ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン19.8g(53.4

(154)

特開2002-308857

305

ミリモル)を25%臭化水素-酢酸溶液170mlに加え、40~50℃で、2時間攪拌した。反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水および食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、淡黄色結晶(融点120.0~122.0℃)の3-(5-クロロ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン12.0g(収率60.6%)を得た。

(¹H-NMR値(CDCl₃/TMS δ(ppm)) : 4.25(2H, s), 2.81(2H, s), 1.44(6H, s)

【0347】<実施例11>

3-(5-クロロ-1-ジフルオロメチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン(本発明化合物番号3-0008)及び3-(3-クロロ-1-ジフルオロメチル-5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン(本発明化合物番号3-0009)の製造

3-(5-クロロ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン2.3g(7.3ミリモル)のN,N-ジメチルホルムアミド50ml溶液に、無水炭酸カリウム3.1g(22.5ミリモル)を加え、クロロジフルオロメタンを反応溶液に吹き込み、130~140℃で3時間攪拌した。反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水および食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサン-酢酸エチル混合溶媒)で精製し、淡黄色結晶(融点41.0~42.0℃)の3-(5-クロロ-1-ジフルオロメチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン0.69g(収率25.8%)および白色粉末(融点89.0~90.0℃)の3-(3-クロロ-1-ジフルオロメチル-5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン0.54g(収率20.2%)を得た。

【0348】3-(5-クロロ-1-ジフルオロメチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン

(¹H-NMR値(CDCl₃/TMS δ(ppm)) : 7.22(1H, t), 4.25(2H, s), 2.80(2H, s), 1.44(6H, s)

3-(3-クロロ-1-ジフルオロメチル-5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン

(¹H-NMR値(CDCl₃/TMS δ(ppm)) 7.19(1H, t), 4.28(2

306

H, s), 2.80(2H, s), 1.44(6H, s)

【0349】<実施例12>

3-(5-クロロ-1-ジフルオロメチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン(本発明化合物番号3-0010)の製造

3-(5-クロロ-1-ジフルオロメチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン0.69g(1.9ミリモル)のクロロホルム20ml溶液に、氷冷下、m-クロロ過安息香酸1.4g(純度70%, 1ミリモル)を加え1時間攪拌した。その後、さらに室温で12時間攪拌した。反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム水溶液、水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、得られた固体をn-ヘキサンで洗浄し、白色粉末(融点126.0~127.0℃)の3-(5-クロロ-1-ジフルオロメチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン0.4g(収率53.3%)を得た。

(¹H-NMR値(CDCl₃/TMS δ(ppm)) : 7.26(1H, t), 4.68(2H, s), 3.11(2H, s), 1.53(6H, s)

【0350】<実施例13>

3-(3-クロロ-1-ジフルオロメチル-5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン(本発明化合物番号3-0011)の製造

3-(3-クロロ-1-ジフルオロメチル-5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン0.54g(1.5ミリモル)のクロロホルム20ml溶液に、氷冷下、m-クロロ過安息香酸1.1g(純度70%, 6.4ミリモル)を加え1時間攪拌した。その後、さらに室温で12時間攪拌した。反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム水溶液、水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、得られた固体をn-ヘキサンで洗浄し、白色粉末(融点136.0~137.0℃)の3-(3-クロロ-1-ジフルオロメチル-5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン0.47g(収率79.7%)を得た。

(¹H-NMR値(CDCl₃/TMS δ(ppm)) : 7.23(1H, t), 4.71(2H, s), 3.11(2H, s), 1.53(6H, s)

【0351】<実施例14>

5,5-ジメチル-3-(3-メトキシ-1-メチル-5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメ

(155)

特開2002-308857

307

チルチオ)-2-イソオキサゾリン(本発明化合物番号3-0024)の製造

5,5-ジメチル-3-エチルスルホニル-2-イソオキサゾリン3.3g(17.3ミリモル)のN,N-ジメチルホルムアミド10ml溶液に、水酸化ナトリウム水和物3.1g(純度70%, 22.0ミリモル)を加え2時間撹拌した。その後、無水炭酸カリウム3.1g(22.0ミリモル)、ロンガリット2.7g(17.5ミリモル)及び4-クロロメチル-3-メトキシ-1-メチル-5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール4.0g(17.5ミリモル)を加え、さらに室温で2時間撹拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサン-酢酸エチル混合溶媒)で精製し、5,5-ジメチル-3-(3-メトキシ-1-メチル-5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-2-イソオキサゾリン2.8g(収率52.0%)を得た。

【0352】<実施例15>

5,5-ジメチル-3-(3-ヒドロキシ-1-メチル-5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-2-イソオキサゾリン(本発明化合物番号3-0025)の製造
25%臭化水素酸酢酸溶液20mlに5,5-ジメチル-3-(3-メトキシ-1-メチル-5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-2-イソオキサゾリン3.3g(10.6ミリモル)を加え、50℃で3時間撹拌した。反応終了後、反応溶液減圧下溶媒を留去し、得られた残渣を水中に注いだ。析出した結晶を濾取し水洗後乾燥し、目的とする5,5-ジメチル-3-(3-ヒドロキシ-1-メチル-5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-2-イソオキサゾリン3.1g(収率96.0%)を得た。

【0353】<実施例16>

5,5-ジメチル-3-(3-エトキシ-1-メチル-5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-2-イソオキサゾリン(本発明化合物番号3-0026)の製造
5,5-ジメチル-3-(3-ヒドロキシ-1-メチル-5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-2-イソオキサゾリン0.30g(1.0ミリモル)のN,N-ジメチルホルムアミド10ml溶液に無水炭酸カリウム0.20g(1.3ミリモル)及びヨウ化エチル0.20g(1.5ミリモル)を加え、50℃で3時間撹拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、目的とする5,5-ジメチル-3-(3-エトキシ

308

-1-メチル-5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-2-イソオキサゾリン0.30g(収率92.0%)を得た。

【0354】<実施例17>

5,5-ジメチル-3-(3-エトキシ-1-メチル-5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルスルホニル)-2-イソオキサゾリン(本発明化合物番号3-0012)の製造

5,5-ジメチル-3-(3-エトキシ-1-メチル-5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-2-イソオキサゾリン0.30g(0.92ミリモル)のクロロホルム10ml溶液に、氷冷下、m-クロロ過安息香酸0.68g(純度70%, 2.76ミリモル)を加え、室温で5時間撹拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム水溶液及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、析出した結晶をヘキサンで洗浄し、白色結晶(融点124~125℃)の5,5-ジメチル-3-(3-エトキシ-1-メチル-5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルスルホニル)-2-イソオキサゾリン0.24g(収率73.0%)を得た。

(¹H-NMR値(CDC1₃/TMS δ(ppm)): 4.50(2H,s), 4.27(2H,q), 3.86(3H,s), 3.04(2H,s), 1.49(6H,s), 1.39(3H,t)

【0355】<実施例18>

5,5-ジメチル-3-(5-フルオロ-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-2-イソオキサゾリン(本発明化合物番号3-0027)の製造

5,5-ジメチル-3-メチルスルホニル-2-イソオキサゾリン21.3g(120.3ミリモル)のN,N-ジメチルホルムアミド200ml溶液に、水酸化ナトリウム19.3g(純度70%, 344.6ミリモル)を加え1時間撹拌した。その後、無水炭酸カリウム16.7g(121.0ミリモル)、ロンガリット18.6g(120.7ミリモル)を加え、更に2時間撹拌後、4-ブロモメチル-5-フルオロ-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール31.4g(120.3ミリモル)を氷冷下加えた。その後、室温で2時間撹拌し、反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水および食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、黄色油状物の5,5-ジメチル-3-(5-フルオロ-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-2-イソオキサゾリン29.0g(収率90.3%)を得た。

(¹H-NMR値(CDC1₃/TMS δ(ppm)): 4.24(2H, s), 3.90(3H, s), 2.78(2H, s), 1.42(6H, s)

(156)

特開2002-308857

309

【0356】＜実施例19＞

5,5-ジメチル-3-(5-メトキシ-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-2-イソオキサゾリン(本発明化合物番号3-0028)の製造

5,5-ジメチル-3-(5-フルオロ-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-2-イソオキサゾリン0.5g(1.6ミリモルのメタノール20ml)溶液に、ナトリウムメトキシド0.77g(4.0ミリモル, 28%メタノール溶液)を加え、還流下、4時間攪拌した。反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水および食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、黄色油状物の5,5-ジメチル-3-(5-メトキシ-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-2-イソオキサゾリン0.5g(収率96.7%)を得た。

(¹H-NMR値(CDC₃/TMS δ(ppm)) : 4.26(2H,s), 4.07(3H,s), 3.72(3H,s), 2.80(2H,s), 1.43(6H,s)

【0357】＜実施例20＞

5,5-ジメチル-3-(5-メトキシ-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルスルホニル)-2-イソオキサゾリン(本発明化合物番号3-0013)の製造

5,5-ジメチル-3-(5-メトキシ-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-2-イソオキサゾリン0.5g(1.5ミリモルのクロロホルム20ml)溶液に、氷冷下、m-クロロ過安息香酸1.3g(純度70%, 7.5ミリモル)を加え1時間攪拌した。その後、さらに室温で12時間攪拌した。反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム水溶液、水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、得られた固体をn-ヘキサンで洗浄し、白色粉末(融点113.0~114.0℃)の5,5-ジメチル-3-(5-メトキシ-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルスルホニル)-2-イソオキサゾリン0.31g(収率58.2%)を得た。

(¹H-NMR値(CDC₃/TMS δ(ppm)) : 4.60(2H,s), 4.11(3H,s), 3.79(3H,s), 3.10(2H,s), 1.51(6H,s)

【0358】＜実施例21＞

3-(5-(2-クロロフェノキシ)-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン(本発明化合物番号3-0029)の製造

2-クロロフェノール0.44g(3.4ミリモル)のN,N-ジメチルホルムアミド30ml溶液に、水素化ナト

310

リウム0.2g(8.3ミリモル, 純度60%)を氷冷下に加え、1時間攪拌した後、更に5,5-ジメチル-3-(5-フルオロ-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-2-イソオキサゾリン0.7g(2.2ミリモル)を加え、120~130℃で5時間攪拌した。反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水および食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサン-酢酸エチル混合溶媒)で精製し、黄色油状物の3-(5-(2-クロロフェノキシ)-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン0.63g(収率66.7%)を得た。

【0359】＜実施例22＞

3-(5-(2-クロロフェノキシ)-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルスルホニル)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン(本発明化合物番号3-0014)の製造

3-(5-(2-クロロフェノキシ)-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン0.63g(1.5ミリモル)のクロロホルム20ml溶液に、氷冷下、m-クロロ過安息香酸1.0g(純度70%, 5.8ミリモル)を加え1時間攪拌した。その後、さらに室温で12時間攪拌した。反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム水溶液、水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、得られた固体をn-ヘキサンで洗浄し、白色粉末(融点67.0~70.0℃)の3-(5-(2-クロロフェノキシ)-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルスルホニル)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン0.31g(収率45.7%)を得た。

(¹H-NMR値(CDC₃/TMS δ(ppm)) : 7.50-6.91(4H,m), 4.45(2H,s), 3.71(3H,s), 3.03(2H,s), 1.47(6H,s)

【0360】＜実施例23＞

3-(5-シクロペンチルオキシ)-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン(本発明化合物番号3-0030)の製造

トリフェニルホスフィン0.43g(1.6ミリモル)のベンゼン10ml溶液にシクロペンタノール0.14g(1.6ミリモル), 5,5-ジメチル-3-(5-ヒドロキシ-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-2-イソオキサゾリン0.5g(1.6ミリモル), 及びアゾジカルボン酸ジエチルエステル0.7g(40%トルエン溶液, 1.6ミリ

(157)

特開2002-308857

311

モル)を加え、室温で12時間攪拌した。反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水および食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサン-酢酸エチル混合溶媒)で精製し、無色透明油状物の3-(5-シクロペンチルオキシ-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン0.52 g(収率85.2%)を得た。

【0361】<実施例24>

3-(5-シクロペンチルオキシ-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルスルホニル)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン(本発明化合物番号3-0015)の製造

3-(5-シクロペンチルオキシ-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン0.52 g(1.4ミリモル)のクロロホルム20 ml溶液に、氷冷下、m-クロロ過安息香酸0.85 g(純度70%, 4.9ミリモル)を加え1時間攪拌した。その後、さらに室温で12時間攪拌した。反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム水溶液、水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、得られた固体をn-ヘキサンで洗浄し、白色粉末(融点113.0~114.0℃)の3-(5-シクロペンチルオキシ-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルスルホニル)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン0.2 g(収率35.5%)を得た。

(¹H-NMR値(CDC₃Cl₂/TMS δ(ppm)): 5.03(1H, br), 4.60(2H, s), 3.73(3H, s), 3.05(2H, s), 1.88-1.70(8H, m), 1.50(6H, s)

【0362】<実施例25>

3-(5-シアノ-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン(本発明化合物番号3-0031)の製造

5,5-ジメチル-3-(5-フルオロ-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-2-イソオキサゾリン0.5 g(1.6ミリモル)のN,N-ジメチルホルムアミド30 ml溶液にシアニ化ナトリウム0.2 g(4.0ミリモル)を加え、40℃で1時間攪拌した。反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水および食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、黄色油状物の3-(5-シアノ-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5,5-ジメチル-2-イソ

312

キサゾリンの粗化合物0.9 gを得た。

(¹H-NMR値(CDC₃Cl₂/TMS δ(ppm)): 4.30(2H, s), 4.08(3H, s), 2.81(2H, s), 1.43(6H, s)

【0363】<実施例26>

3-(5-シアノ-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルスルホニル)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン(本発明化合物番号3-0016)の製造

3-(5-シアノ-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン0.9 g(粗化合物)のクロロホルム50 ml溶液に、氷冷下、m-クロロ過安息香酸2.1 g(純度70%, 12.2ミリモル)を加え1時間攪拌した。その後、さらに室温で12時間攪拌した。反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム水溶液、水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、得られた固体をn-ヘキサンで洗浄し、白色粉末(融点105.0~108.0℃)の3-(5-シアノ-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルスルホニル)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン0.43 g(収率76.4%)を得た。

(¹H-NMR値(CDC₃Cl₂/TMS δ(ppm)): 4.73(2H, s), 4.16(3H, s), 3.14(2H, s), 1.53(6H, s)

【0364】<実施例27>

3-(3,5-ジクロロ-1-エチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン(本発明化合物番号3-0032)の製造

5,5-ジメチル-3-エチルスルホニル-2-イソオキサゾリン0.7 g(3.7ミリモル)のN,N-ジメチルホルムアミド30 ml溶液に、水酸化ナトリウム0.6 g(純度70%, 10.7ミリモル)を加え1時間攪拌した。その後、無水炭酸カリウム0.51 g(3.7ミリモル)、ロンガリット0.56 g(3.6ミリモル)を加え、更に2時間攪拌後、4-ブロモメチル-3,5-ジクロロ-1-エチル-1H-ピラゾール0.9 g(3.5ミリモル)を氷冷下加えた。その後、室温で2時間攪拌し、反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水および食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサン-酢酸エチル混合溶媒)で精製し、無色透明油状物の3-(3,5-ジクロロ-1-エチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン0.8 g(収率70.8%)を得た。

(¹H-NMR値(CDC₃Cl₂/TMS δ(ppm)): 4.14(2H, s), 4.14(2H, q), 2.81(2H, s), 1.43(6H, s), 1.42(3H, t)

【0365】<実施例28>

(158)

特開2002-308857

313

3-(3,5-ジクロロ-1-エチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルスルホニル)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン(本発明化合物番号3-0017)の製造

3-(3,5-ジクロロ-1-エチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン(0.8g(2.6ミリモル)のクロロホルム20ml溶液に、氷冷下、m-クロロ過安息香酸2.0g(純度70%, 11.6ミリモル)を加え1時間攪拌した。その後、さらに室温で12時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム水溶液、水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、得られた固体をn-ヘキサンで洗浄し、白色粉末(融点105.0~107.0℃)の3-(3,5-ジクロロ-1-エチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルスルホニル)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン0.41g(収率46.6%)を得た。

(¹H-NMR値(CDCl₃/TMS δ(ppm)) : 4.48(2H,s), 4.19(2H,q), 3.05(2H,s), 1.51(6H,s), 1.45(3H,t)

[0366]<実施例29>

3-(5-クロロ-3-ジフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン(本発明化合物番号3-0020)の製造

5,5-ジメチル-3-エチルスルホニル-2-イソオキサゾリン1.9g(10.0ミリモル)のN,N-ジメチルホルムアミド30ml溶液に、水酸化ナトリウム水和物1.2g(純度70%, 15.0ミリモル)を加え2時間攪拌した。その後、無水炭酸カリウム2.1g(15.0ミリモル)、ロンガリット2.3g(15.0ミリモル)及び4-ブプロメチル-5-クロロ-3-ジフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール2.6g(10.0ミリモル)を加え、さらに室温で15時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサン-酢酸エチル混合溶媒)で精製し、無色粘性液体(Δn, 40 °D=1.5183)の3-(5-クロロ-3-ジフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン2.1g(収率68.0%)を得た。

(¹H-NMR値(CDCl₃/TMS δ(ppm)) : 6.70(1H,t,J=54.2Hz), 4.24(2H,s), 3.85(3H,s), 2.80(2H,s), 1.42(6H,s)

[0367]<実施例30>

3-(5-クロロ-3-ジフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルスルホニル)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン(本発明化合物

314

番号3-0018)の製造

3-(5-クロロ-3-ジフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン1.8g(5.8ミリモル)のクロロホルム15ml溶液に、氷冷下、m-クロロ過安息香酸3.6g(純度70%, 14.5ミリモル)を加え、室温で22時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム水溶液及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、析出した結晶をヘキサンで洗浄し、白色結晶(融点78~79℃)の3-(5-クロロ-3-ジフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルスルホニル)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン1.7g(収率85.9%)を得た。

(¹H-NMR値(CDCl₃/TMS δ(ppm)) 6.80(1H,t,J=54.8Hz), 4.60(2H,s), 3.91(3H,s), 3.08(2H,s), 1.51(6H,s) [0368]<実施例31>

5,5-ジメチル-3-(5-メチル-3-トリフルオロメチルイソキサゾール-4-イルメチルチオ)-2-イソオキサゾリン(本発明化合物番号4-0003)の製造

5,5-ジメチル-3-メチルスルホニル-2-イソオキサゾリン0.4g(2.3ミリモル)のN,N-ジメチルホルムアミド10ml溶液に、水酸化ナトリウム水和物0.4g(純度70%, 4.6ミリモル)を加え2時間攪拌した。その後、炭酸カリウム0.3g(2.3ミリモル)、ロンガリット0.4g(2.3ミリモル)及び4-ブプロメチル-5-メチル-3-トリフルオロメチルイソキサゾール0.5g(1.8ミリモル)を加え、さらに室温で14時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサン-酢酸エチル混合溶媒)で精製し、5,5-ジメチル-3-(5-メチル-3-トリフルオロメチルイソキサゾール-4-イルメチルチオ)-2-イソオキサゾリン0.4g(収率70.0%)を得た。

(¹H-NMR値(CDCl₃/TMS δ(ppm)) : 4.11(2H,s), 2.77(2H,s), 2.54(3H,s), 1.42(6H,s)

[0369]<実施例32>

5,5-ジメチル-3-(5-メチル-3-トリフルオロメチルイソキサゾール-4-イルメチルスルホニル)-2-イソオキサゾリン(本発明化合物番号4-0001)の製造

5,5-ジメチル-3-(5-メチル-3-トリフルオロメチルイソキサゾール-4-イルメチルチオ)-2-イソオキサゾリン0.4g(1.3ミリモル)のクロロホルム10ml溶液に、氷冷下、m-クロロ過安息香酸0.8

(159)

特開2002-308857

315

g (純度70%, 3.2ミリモル)を加え、室温で4時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム水溶液及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、析出した結晶をヘキサンで洗浄し、白色結晶(融点135~136℃)の5,5-ジメチル-3-(5-メチル-3-トリフルオロメチルイソキサゾール-4-イルメチルスルホニル)-2-イソキサゾリン0.4g(収率95.0%)を得た。

(¹H-NMR値(CDCl₃/TMS δ(ppm)) : 4.54(2H, s), 3.11(2H, s), 2.61(3H, s), 1.52(6H, s)

[0370] <実施例33>

[(5-クロロ-3-メチル-イソチアゾール-4-イル)-メチルチオ]-5,5-ジメチル-2-イソキサゾリン(本発明化合物番号4-0004)の製造
5,5-ジメチル-3-メチルスルホニル-2-イソキサゾリン0.89g(5.00ミリモル)のN,N-ジメチルホルムアミド10ml溶液に、室温で水酸化ナトリウム0.82g(純度70%, 10.00ミリモル)を加え2時間攪拌した。その後反応溶液中に無水炭酸カリウム0.70g(5.00ミリモル)、ロンガリット0.78g(5.00ミリモル)及び5-クロロ-4-クロロメチル-3-メチルイソチアゾール0.91g(5.00ミリモル)を加え、さらに室温で一晩攪拌した。反応終了確認後、水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、[(5-クロロ-3-メチル-イソチアゾール-4-イル)-メチルチオ]-5,5-ジメチル-2-イソキサゾリン1.38g(収率定量的)を得た。

[0371] <実施例34>

[(5-クロロ-3-メチル-イソチアゾール-4-イル)-メチルスルホニル]-5,5-ジメチル-2-イソキサゾリン(本発明化合物番号4-0002)の製造
[(5-クロロ-3-メチル-イソチアゾール-4-イル)-メチルチオ]-5,5-ジメチル-2-イソキサゾリン1.38g(5.00ミリモル)のクロロホルム20ml溶液に、m-クロロ過安息香酸2.96g(純度70%, 12.00ミリモル)を氷冷下に加え、1時間攪拌し、さらに室温で一晩攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム水溶液及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、淡黄色粉末(融点113~114℃)の[(5-クロロ-3-メチル-イソチアゾール-4-イル)-メチルスルホニル]-5,5-ジメチル-2-イソキサゾリン0.65g(収率47. 50

316

0%)を得た。

(¹H-NMR値(CDCl₃/TMS δ(ppm)) : 8.89(1H, s), 4.67(2H, s), 3.05(2H, s), 2.59(3H, s), 1.51(6H, s)

[0372] <実施例35>

5,5-ジメチル-3-[2,5-ジメチル-4-(1-メトキシイミノエチル)-チオフエン-3-イルメチルチオ]-2-イソキサゾリン(本発明化合物番号2-002)の製造

3-(4-アセチル-2,5-ジメチルチオフエン-3-イルメチルチオ)-5,5-ジメチル-2-イソキサゾリン1.0g(3.4ミリモル)のエタノール50ml溶液にO-メチルヒドロキシルアミン塩酸塩0.57g(6.8ミリモル)と酢酸ナトリウム0.56g(6.8ミリモル)を加え、還流下、5時間攪拌した。反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水および食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサン-酢酸エチル混合溶媒)で精製し、黄色油状物の5,5-ジメチル-3-[2,5-ジメチル-4-(1-メトキシイミノエチル)-チオフエン-3-イルメチルチオ]-2-イソキサゾリン0.4g(36.4%)を得た。

(¹H-NMR値(CDCl₃/TMS δ(ppm)) : 4.21(2H, s), 3.95(3H, s), 2.76(2H, s), 2.38(3H, s), 2.34(3H, s), 2.13(3H, s), 1.42(6H, s)

[0373] <実施例36>

5,5-ジメチル-3-[2,5-ジメチル-4-(1-メトキシイミノエチル)-チオフエン-3-イルメチルスルホニル]-2-イソキサゾリン(本発明化合物番号2-0001)の製造

5,5-ジメチル-3-[2,5-ジメチル-4-(1-メトキシイミノエチル)-チオフエン-3-イルメチルチオ]-2-イソキサゾリン0.4g(1.2ミリモル)のクロロホルム30ml溶液に、m-クロロ過安息香酸0.61g(純度70%, 3.5ミリモル)を氷冷下に加え1時間攪拌し、さらに室温で12時間攪拌した。反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム水溶液、水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサン-酢酸エチル混合溶媒)で精製し、白色結晶(融点95.0~96.0℃)の5,5-ジメチル-3-[4-(1-メトキシイミノエチル-2,5-ジメチル-チオフエン-3-イルメチルスルホニル)-2-イソキサゾリン0.35g(80%)を得た。

(¹H-NMR値(CDCl₃/TMS δ(ppm)) : 4.79(2H, s), 3.95(3H, s), 2.93(2H, s), 2.42(3H, s), 2.37(3H, s), 2.17(3H, s), 1.47(6H, s)

[0374] <実施例37>

(160)

特開2002-308857

317

5,5-ジメチル-3-(4-トリフルオロメチル-ピリジン-3-イルメチルスルホニル)-2-イソオキサゾリン (本発明化合物番号7-0003)の製造

5,5-ジメチル-3-エチルスルホニル-2-イソオキサゾリン0.3g(1.6ミリモル)のN,N-ジメチルホルムアミド20ml溶液に、水酸化ナトリウム0.26g(純度70%, 4.6ミリモル)を加え1時間攪拌した。その後、無水炭酸カリウム0.22g(1.6ミリモル)、ロンガリット0.25g(1.6ミリモル)を加え、更に2時間攪拌後、3-ブロモメチル-4-トリフルオロメチル-ピリジン0.3g(1.3ミリモル)を氷冷下加えた。その後、室温で2時間攪拌し、反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水および食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサン-酢酸エチル混合溶媒)で精製し、黄色油状物の5,5-ジメチル-3-(4-トリフルオロメチル-ピリジン-3-イルメチルスルホニル)-2-イソオキサゾリン 0.45g(収率98.9%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ 値 (CDCl_3/TMS δ (ppm)): 8.98(1H, s), 8.70(1H, d), 7.51(1H, d), 4.47(2H, s), 2.79(2H, s), 1.43(6H, s)

【0375】<実施例38>

5,5-ジメチル-3-(4-トリフルオロメチル-ピリジン-3-イルメチルスルホニル)-2-イソオキサゾリン (本発明化合物番号7-0001) および5,5-ジメチル-3-(4-トリフルオロメチル-ピリジン-N-オキシド-3-イルメチルスルホニル)-2-イソオキサゾリン (本発明化合物番号7-0002)の製造

5,5-ジメチル-3-(4-トリフルオロメチル-ピリジン-3-イルメチルスルホニル)-2-イソオキサゾリン 0.45g (1.6ミリモル)のクロロホルム20ml溶液に、氷冷下、m-クロロ過安息香酸0.77g(純度70%, 4.5ミリモル)を加え1時間攪拌した。その後、さらに室温で12時間攪拌した。反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム水溶液、水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサン-酢酸エチル混合溶媒)で精製し、淡黄色結晶(融点77.0~80.0℃)の5,5-ジメチル-3-(4-トリフルオロメチル-ピリジン-3-イルメチルスルホニル)-2-イソオキサゾリン0.06g(収率12.0%)および白色結晶(融点114.0~116.0℃)の5,5-ジメチル-3-(4-トリフルオロメチル-ピリジン-N-オキシド-3-イルメチルスルホニル)-2-イソオキサゾリン0.12g(収率23.1%)を得た。

5,5-ジメチル-3-(4-トリフルオロメチル-ピリ

318

ジン-3-イルメチルスルホニル)-2-イソオキサゾリン

$^1\text{H-NMR}$ 値 (CDCl_3/TMS δ (ppm)): 8.98(1H, s), 8.84(1H, d), 7.64(1H, d), 4.92(2H, s), 3.09(2H, s), 1.52(6H, s)

5,5-ジメチル-3-(4-トリフルオロメチル-ピリジン-N-オキシド-3-イルメチルスルホニル)-2-イソオキサゾリン

$^1\text{H-NMR}$ 値 (CDCl_3/TMS δ (ppm)): 8.50(1H, s), 8.25(1H, d), 7.59(1H, d), 4.81(2H, s), 3.12(2H, s), 1.53(6H, s)

【0376】<実施例39>

5,5-ジメチル-[(4-メトキシ-6-トリフルオロメチルピリミジン-5-イル)-メチルスルホニル]-2-イソオキサゾリン (本発明化合物番号8-0002)の製造

5,5-ジメチル-3-メチルスルホニル-2-イソオキサゾリン0.35g(2.00ミリモル)のジメチルホルムアミド10ml溶液に、室温で水酸化ナトリウム0.32g(純度70%, 4.00ミリモル)を加え2時間攪拌した。その後反応溶液中に無水炭酸カリウム0.28g(2.00ミリモル)、ロンガリット0.31g(2.00ミリモル)及び5-クロロメチル-4-メトキシ-6-トリフルオロメチルピリミジン0.45g(2.00ミリモル)を加え、さらに室温で2時間攪拌した。反応終了確認後、水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、5,5-ジメチル-[(4-メトキシ-6-トリフルオロメチルピリミジン-5-イル)-メチルスルホニル]-2-イソオキサゾリン 0.55g(収率85.9%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ 値 (CDCl_3/TMS δ (ppm)): 8.81(1H, s), 4.44(2H, d), 4.12(3H, s), 2.81(2H, s), 1.45(6H, s)

【0377】<実施例40>

5,5-ジメチル-[(4-メトキシ-6-トリフルオロメチルピリミジン-5-イル)-メチルスルホニル]-2-イソオキサゾリン (本発明化合物番号8-0001)の製造

5,5-ジメチル-[(4-メトキシ-6-トリフルオロメチルピリミジン-5-イル)-メチルスルホニル]-2-イソオキサゾリン0.55g(1.71ミリモル)のクロロホルム20ml溶液に、氷冷下でm-クロロ過安息香酸1.05g(純度70%, 4.28ミリモル)を加え1時間攪拌し、さらに室温で4時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム水溶液及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、白色羽毛状結晶(融点175~176℃)の5,5-ジメチル-[(4-

メトキシ-6-トリフルオロメチルピリミジン-5-イル)-メチルスルホニル]-2-イソオキサゾリン] 0.45 g (収率75.0%)を得た。

(¹H-NMR値 (CDCl₃/TMS δ (ppm)) : 8.89(1H,s), 5.00(2H,d), 4.11(3H,s), 3.11(2H,s), 1.53(6H,s)

[0378] <実施例41>

3-(5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン-3-イルチオメチル)-2-トリフルオロメチル-6,7-ジヒドロ-5H-ピラゾロ[5,1-b][1,3]オキサジン (本発明化合物番号3-0033) の製造

水素化ナトリウム0.11 g (2.8ミリモル)のN,N-ジメチルホルムアミド15 ml懸濁液に3-[5-クロロ-1-(3-ヒドロキシプロピル)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イル-メチルチオ]-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾール0.82 g (2.3ミリモル)のN,N-ジメチルホルムアミド5 ml溶液を室温で滴下した。滴下終了後、反応溶液を室温で30分攪拌し、その後100℃に加熱し1時間攪拌した。反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層をクエン酸水溶液、食塩水で洗浄後、硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、3-(5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン-3-イルチオメチル)-2-トリフルオロメチル-6,7-ジヒドロ-5H-ピラゾロ[5,1-b][1,3]オキサジン0.77 g (収率100%)を得た。

(¹H-NMR値 (CDCl₃/TMS δ (ppm)) : 4.37(2H,t), 4.19(2H,t), 4.15(2H,s), 2.80(2H,s), 2.31(2H,m), 1.42(6*

*H,s)

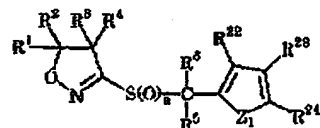
[0379] <実施例42>

3-(5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン-3-イルスルホニルメチル)-2-トリフルオロメチル-6,7-ジヒドロ-5H-ピラゾロ[5,1-b][1,3]オキサジン (本発明化合物番号3-0019) の製造

3-(6,7-ジヒドロ-3-トリフルオロメチル-5H-ピラゾロ[5,1-b][1,3]オキサジン-4-イル-メチルチオ)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン0.77 g (2.3ミリモル)のクロロホルム溶液20 mlに、氷冷下、m-クロロ過安息香酸1.25 g (純度70%, 5.1ミリモル)を加え1時間攪拌した。その後、さらに室温で12時間攪拌した。反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム水溶液、水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、白色粉末 (融点151.0-152.0℃) の3-(5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン-3-イルスルホニルメチル)-2-トリフルオロメチル-6,7-ジヒドロ-5H-ピラゾロ[5,1-b][1,3]オキサジン0.36 g (収率43%)を得た。(¹H-NMR値 (CDCl₃/TMS δ (ppm)) : 4.47(2H,s), 4.40(2H,t), 4.23(2H,t), 3.09(2H,s), 2.34(2H,m), 1.50(6H,s)

[0380]

[表131]

|  | | | | | | | | | | | | |
|---|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|----------------|-----------------|-----------------|-----------------|---|
| 化合物番号 | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | Z ₁ | R ²² | R ²³ | R ²⁴ | 融点(℃) 又は 屈折率 (n _D ²⁰) |
| 1-0001 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | Me | H | H | 66-68 |
| 1-0002 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | Cl | Me | H | 87-88 |
| 1-0003 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | H | H | Me | 95-97 |
| 1-0004 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | Cl | H | H | 70-72 |
| 1-0005 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | H | H | Cl | 118-119 |
| 1-0006 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | H | H | H | 測定不可 |
| 1-0007 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | H | H | C(=O)OMe | 124-125 |

[0381]

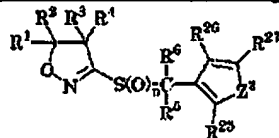
[表132]

(152)

特開2002-308857

321

322

|  | | | | | | | | | | | | |
|---|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|----------------|-----------------|-----------------|-----------------|--|
| 化合物 番号 | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | Z ¹ | R ²⁵ | R ²⁶ | R ²⁷ | 融点(℃) 又は 屈折率(n _D ²⁰) |
| 2-0001 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | Me | C(=NOMe)Me | Me | 95-96 |
| 2-0002 | Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | Me | C(=NOMe)Me | Me | |
| 2-0003 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | H | H | H | 99-101 |
| 2-0004 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | H | OMe | H | 96-97 |
| 2-0005 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | Cl | H | Cl | 125-127 |
| 2-0006 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | Cl | Cl | Cl | 158-160 |
| 2-0007 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | Me | Me | Me | 117-117 |
| 2-0008 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | Me | C(=O)Me | Me | 146-148 |
| 2-0009 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | Ph | C(=O)Me | Me | 1.5730 |
| 2-0010 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | Ph | C(=NOMe)Me | Me | 129-131 |
| 2-0011 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | Cl | C(=O)OMe | Cl | 157-158 |
| 2-0012 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | Cl | C(=O)NHMe | Cl | 178-180 |
| 2-0013 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | H | H | H | 58-61 |
| 2-0014 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | Me | H | Cl | 180-181 |

【0382】

【表133】

(153)

特開2002-308857

323

324

| 化合物 番号 | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ²⁹ | R ²⁸ | R ³⁰ | 融点(℃)又は 屈折率(n _D ²⁰) |
|-----------|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|------------------|-------------------------------------|--------------------|---|
| 3-0001 | Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Ph | Cl | 89-90 |
| 3-0002 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | Cl | 132-133 |
| 3-0003 | Me | Me | H | H | 1 | H | H | Ph | Me | Cl | 測定不可 |
| 3-0004 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | SO ₂ Et | 158-160 |
| 3-0005 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | N(Me) ₂ | 150-151 |
| 3-0006 | Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Bu-t | Cl | 79-81 |
| 3-0007 | Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | H | Cl | 120-122 |
| 3-0008 | Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CHF ₂ | Cl | 41-42 |
| 3-0009 | Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | CHF ₂ | CF ₃ | 89-90 |
| 3-0010 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CHF ₂ | Cl | 126-127 |
| 3-0011 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CHF ₂ | CF ₃ | 136-137 |
| 3-0012 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | OEt | Me | CF ₃ | 124-125 |
| 3-0013 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | OMe | 113-114 |
| 3-0014 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | O(2-Cl)Ph | 67-70 |
| 3-0015 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | OPen-c | 113-114 |
| 3-0016 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | CN | 105-108 |
| 3-0017 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | Et | Cl | 105-107 |
| 3-0018 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CHF ₂ | Me | Cl | 78-79 |
| 3-0019 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | -(CH ₂) ₃ O- | | 151-152 |
| 3-0020 | Me | Me | H | H | 0 | H | H | CHF ₂ | Me | Cl | 15183 |
| 3-0021 | Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Ph | F | |
| 3-0022 | Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Ph | SEt | |
| 3-0023 | Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Ph | N(Me) ₂ | |
| 3-0024 | Me | Me | H | H | 0 | H | H | OMe | Me | CF ₃ | |
| 3-0025 | Me | Me | H | H | 0 | H | H | OH | Me | CF ₃ | |
| 3-0026 | Me | Me | H | H | 0 | H | H | OEt | Me | CF ₃ | |
| 3-0027 | Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | F | |
| 3-0028 | Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | OMe | |
| 3-0029 | Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | O(2-Cl)Ph | |
| 3-0030 | Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | OPen-c | |
| 3-0031 | Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Me | CN | |
| 3-0032 | Me | Me | H | H | 0 | H | H | Cl | Et | Cl | |
| 3-0033 | Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | -(CH ₂) ₃ O- | | |
| 3-0034 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | H | Cl | 138-140 |

【0383】

【表134】

(164)

特開2002-308857

325

326

| 化合物 番号 | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ²⁹ | R ²⁸ | R ³⁰ | 融点(℃)又は 屈折率(n _D ²⁰) |
|-----------|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|-------------------|-----------------|-----------------------------------|---|
| 3-0035 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | Me | Cl | 105-106 |
| 3-0036 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | Me | Me | 148-150 |
| 3-0037 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | Me | Cl | 99-101 |
| 3-0038 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | Me | Cl | 143-145 |
| 3-0039 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | Cl | 115-116 |
| 3-0040 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | Me | CF ₃ | 120-122 |
| 3-0041 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | F | 79-82 |
| 3-0042 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | OH | 90-92 |
| 3-0043 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | OMe | Me | CF ₃ | 125-126 |
| 3-0044 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | OEt | 92-94 |
| 3-0045 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | OPr-i | 69-71 |
| 3-0046 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | OPr | 82-83 |
| 3-0047 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | OBu-t | 86-89 |
| 3-0048 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | OBu | 61-62 |
| 3-0049 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | OHex-c | 124-125 |
| 3-0050 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | OCH ₂ Pr-c | 93-94 |
| 3-0051 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | OCH ₂ Pen-c | 112-113 |
| 3-0052 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | OCH ₂ Hex-c | 56-59 |
| 3-0053 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | OCH ₂ C≡CH | 92-93 |
| 3-0054 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | OCHF ₂ | 129-130 |
| 3-0055 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | OCHF ₂ | Me | CF ₃ | 測定不可 |
| 3-0056 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | OCH ₂ CHF ₂ | 89-91 |
| 3-0057 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | OCH ₂ CF ₃ | 93-95 |
| 3-0058 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | OCH ₂ CN | 14872 |
| 3-0059 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | OCH ₂ Ph | 79-81 |
| 3-0060 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | OPh | 122-123 |
| 3-0061 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | O(3-Cl)Ph | 測定不可 |
| 3-0062 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | O(3-OMe)Ph | 15059 |
| 3-0063 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | O(4-Cl)Ph | 68-69 |
| 3-0064 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | O(4-Me)Ph | 132-133 |
| 3-0065 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | O(4-OMe)Ph | 115-117 |
| 3-0066 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | OC(=O)Me | 130-131 |
| 3-0067 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | SO ₂ Me | 168-169 |
| 3-0068 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | SEt | 100-102 |
| 3-0069 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | SO ₂ Et | 107-108 |
| 3-0070 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | SO ₂ Ph | 166-168 |
| 3-0071 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | Me | 105-107 |
| 3-0072 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | Ph | Me | Cl | 127-129 |
| 3-0073 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Et | Cl | 111-112 |

【0384】

【表135】

(165)

特開2002-308857

327

328

| 化合物 番号 | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ²⁹ | R ²⁸ | R ³⁰ | 融点(℃)又は 屈折率(n _D ²⁰) |
|-----------|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|-----------------|---------------------------------------|-----------------|---|
| 3-0074 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | Et | CF ₃ | 112-114 |
| 3-0075 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Pr-i | Cl | 157-158 |
| 3-0076 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | Pr-i | CF ₃ | 135-136 |
| 3-0077 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Pr | Cl | 89-90 |
| 3-0078 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | Pr | CF ₃ | 111-113 |
| 3-0079 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Bu-t | H | 101-103 |
| 3-0080 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Bu-t | Cl | 118-119 |
| 3-0081 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Bu-s | Cl | 110-112 |
| 3-0082 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | Bu-s | CF ₃ | 110-111 |
| 3-0083 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Bu-i | Cl | 96-98 |
| 3-0084 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | Bu-i | CF ₃ | 140-141 |
| 3-0085 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Bu | Cl | 89-90 |
| 3-0086 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | Bu | CF ₃ | 108-110 |
| 3-0087 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ Ph | Cl | 132-133 |
| 3-0088 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH ₂ Ph | CF ₃ | 118-120 |
| 3-0089 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Pen-c | Cl | 130-131 |
| 3-0090 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | Pen-c | CF ₃ | 147-148 |
| 3-0091 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Hex-c | Cl | 151-152 |
| 3-0092 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ Pr-c | Cl | 93-95 |
| 3-0093 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH ₂ Pr-c | CF ₃ | 129-130 |
| 3-0094 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | 1-cyclopropylethyl | Cl | 87-89 |
| 3-0095 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | 1-cyclopropylethyl | CF ₃ | 121-123 |
| 3-0096 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ (2-Methylcyclopropyl) | Cl | 102-103 |
| 3-0097 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH ₂ (2-Methylcyclopropyl) | CF ₃ | 118-119 |
| 3-0098 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ Bu-c | Cl | 94-96 |
| 3-0099 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH ₂ Bu-c | CF ₃ | 141-142 |
| 3-0100 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ Pen-c | Cl | 127-129 |
| 3-0101 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH ₂ Pen-c | CF ₃ | 146-149 |
| 3-0102 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ Hex-c | Cl | 152-154 |
| 3-0103 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH ₂ Hex-c | CF ₃ | 113-117 |
| 3-0104 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ CH=CH ₂ | Cl | 78-80 |
| 3-0105 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH ₂ CH=CH ₂ | CF ₃ | 105-106 |
| 3-0106 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ C≡CH | Cl | 73-74 |
| 3-0107 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH ₂ C≡CH | CF ₃ | 108-109 |
| 3-0108 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CHMeC≡CH | Cl | 95-96 |
| 3-0109 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CHMeC≡CH | CF ₃ | 116-118 |
| 3-0110 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ C≡CMe | Cl | 114-115 |
| 3-0111 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH ₂ C≡CMe | CF ₃ | 115-116 |
| 3-0112 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CHF ₂ | OMe | 72-74 |

【0385】

【表136】

(156)

特開2002-308857

329

330

| 化合物 番号 | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ²⁹ | R ²⁸ | R ³⁰ | 融点(℃)又は 屈折率(n _D ²⁰) |
|-----------|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|-----------------|--|-----------------|---|
| 3-0113 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | OMe | CHF ₂ | CF ₃ | 108-109 |
| 3-0114 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ CHF ₂ | Cl | 99-100 |
| 3-0115 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH ₂ CHF ₂ | CF ₃ | 107-109 |
| 3-0116 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ CF ₃ | Cl | 135-136 |
| 3-0117 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH ₂ CF ₃ | CF ₃ | 112-115 |
| 3-0118 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ OMe | Cl | 87-89 |
| 3-0119 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH ₂ OMe | CF ₃ | 125-128 |
| 3-0120 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ OEt | Cl | 97-98 |
| 3-0121 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH ₂ OEt | CF ₃ | 128-129 |
| 3-0122 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OH | Cl | 79-81 |
| 3-0123 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH ₂ CH ₂ OH | CF ₃ | 93-94 |
| 3-0124 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | Cl | 102-104 |
| 3-0125 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CF ₃ | 118-119 |
| 3-0126 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OEt | Cl | 56-59 |
| 3-0127 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH ₂ CH ₂ OEt | CF ₃ | 118-119 |
| 3-0128 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ SMe | Cl | 103-105 |
| 3-0129 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH ₂ SMe | CF ₃ | 128-129 |
| 3-0130 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ SO ₂ Me | Cl | 157-159 |
| 3-0131 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH ₂ SO ₂ Me | CF ₃ | 165-166 |
| 3-0132 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me | Cl | 155-157 |
| 3-0133 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me | CF ₃ | 166-168 |
| 3-0134 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ CN | Cl | 128-129 |
| 3-0135 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH ₂ CN | CF ₃ | 117-118 |
| 3-0136 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ C(=O)OEt | Cl | 127-129 |
| 3-0137 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH ₂ C(=O)OEt | CF ₃ | 143-145 |
| 3-0138 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ C(=O)NH ₂ | Cl | 173-174 |
| 3-0139 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH ₂ C(=O)NH ₂ | CF ₃ | 182-183 |
| 3-0140 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ C(=O)N(Me) ₂ | Cl | 142-143 |
| 3-0141 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH ₂ C(=O)N(Me) ₂ | CF ₃ | 181-182 |
| 3-0142 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ C(=O)Me | Cl | 148-149 |
| 3-0143 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | Cl | CH ₂ C(=O)Me | CF ₃ | 163-164 |
| 3-0144 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ C(=O)Me | Cl | 89-91 |
| 3-0145 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | Ph | Me | 140-141 |
| 3-0146 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | Ph | Cl | 124-125 |
| 3-0147 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | Et | Ph | Cl | 112-113 |
| 3-0148 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | Pr | Ph | Cl | 122-123 |
| 3-0149 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | Pr-i | Ph | Cl | 116-117 |
| 3-0150 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | Bu-t | Ph | Cl | 100-102 |
| 3-0151 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | H | 111-112 |

【0386】

【表137】

(167)

特開2002-308857

331

332

| 化合物 番号 | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ²⁹ | R ²⁸ | R ³⁰ | 融点(℃)又は 屈折率(n _D ²⁰) |
|-----------|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|------------------|--------------------------------------|--------------------|---|
| 3-0152 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | Me | 129-132 |
| 3-0153 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | CF ₃ | 112-113 |
| 3-0154 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | F | 90-91 |
| 3-0155 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | OMe | 104-106 |
| 3-0156 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | OEi | 129-131 |
| 3-0157 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | OPr-i | 86-88 |
| 3-0158 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | OPr | 117-118 |
| 3-0159 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | OBu-t | 105-108 |
| 3-0160 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | OCHF ₃ | 90-92 |
| 3-0161 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | SO ₂ Me | 167-168 |
| 3-0162 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Ph | CN | 113-115 |
| 3-0163 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | (2-Cl)Ph | Cl | 153-154 |
| 3-0164 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | (3-Cl)Ph | Cl | 106-107 |
| 3-0165 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | (4-Cl)Ph | Cl | 142-143 |
| 3-0166 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | (4-F)Ph | Cl | 135-138 |
| 3-0167 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | (4-OMe)Ph | Cl | 136-138 |
| 3-0168 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | (4-Me)Ph | Cl | 129-130 |
| 3-0169 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | (4-NO ₂)Ph | Cl | 145-147 |
| 3-0170 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | (4-CN)Ph | Cl | 91-93 |
| 3-0171 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | (4-C(=O)Me)Ph | Cl | 133-135 |
| 3-0172 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | (4-C(=O)OMe)Ph | Cl | 121-124 |
| 3-0173 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Pyrimidin-2-yl | Cl | 148-150 |
| 3-0174 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl | Cl | 117-118 |
| 3-0175 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | SO ₂ Me | Cl | 146-148 |
| 3-0176 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | SO ₂ Ph | Cl | 145-148 |
| 3-0177 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | C(=O)Me | Cl | 130-131 |
| 3-0178 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | C(=O)Ph | Cl | 114-117 |
| 3-0179 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | C(=O)OMe | Cl | 104-106 |
| 3-0180 | Me | Et | H | H | 2 | H | H | CF ₃ | Me | Cl | 108-110 |
| 3-0181 | Me | Me | H | H | 0 | H | H | CHF ₂ | Me | Cl | 151-83 |
| 3-0182 | Me | Me | H | H | 0 | H | H | Ph | Me | Cl | 76-77 |
| 3-0183 | Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | Bu-t | OMe | 1.4831 |
| 3-0184 | Me | Me | H | H | 0 | H | H | CF ₃ | CH ₂ C(=O)NH ₂ | Cl | 179-180 |
| 3-0185 | Me | Me | H | H | 0 | H | H | Me | Ph | Cl | 58-60 |

【0387】

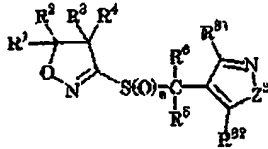
【表138】

(168)

特開2002-308857

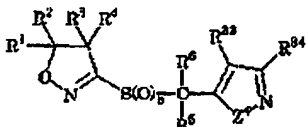
333

334

|  | | | | | | | | | | | |
|---|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|----------------|-----------------|-----------------|---|
| 化合物 番号 | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | Z ³ | R ³¹ | R ³² | 融点(℃) 又は 屈折率 (n _D ²⁰) |
| 4-0001 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | Me | 135-136 |
| 4-0002 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | Me | Cl | 113-114 |
| 4-0003 | Me | Me | H | H | 0 | H | H | O | CF ₃ | Me | |
| 4-0004 | Me | Me | H | H | 0 | H | H | S | Me | Cl | |
| 4-0005 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | Me | Me | 178-179 |
| 4-0006 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | CF ₃ | OEt | 89-91 |
| 4-0007 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | Ph | Me | 81-83 |
| 4-0008 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | S | Me | OEt | 109-111 |

【0388】

* * 【表139】

|  | | | | | | | | | | | |
|--|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|-------------------|-------------------------------------|-----------------|---|
| 化合物 番号 | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | Z ⁴ | R ³³ | R ³⁴ | 融点(℃)又は 屈折率(n _D ²⁰) |
| 5-0001 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | NMe | Cl | Me | 114-115 |
| 5-0002 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | NMe | Cl | Et | 107-108 |
| 5-0003 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | NMe | CF ₃ | H | 142-143 |
| 5-0004 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | NCHF ₂ | -(CH ₂) ₆ - | | 123-125 |
| 5-0005 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | NPh | OEt | Me | 1.5397 |
| 5-0006 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | NPh | OCHF ₂ | Me | 1.5339 |
| 5-0007 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | NPh | CF ₃ | H | 99-101 |
| 5-0008 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | NPh | OCH ₂ CH=CH ₂ | Me | 87-90 |
| 5-0009 | Me | Me | H | H | 1 | H | H | NPh | OCH ₂ CH=CH ₂ | Me | 1.5702 |

【0389】

【表140】

| 化合物 番号 | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | Z ⁵ | R ³⁵ | R ³⁶ | 融点(℃)又は 屈折率(n _D ²⁰) |
|-----------|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|-------------------|------------------------------------|-------------------|---|
| 6-0001 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | NCHF ₂ | -(CH ₂) ₄ - | | 測定不可 |
| 6-0002 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | NPb | H | OEt | 107-108 |
| 6-0003 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | NPb | H | OCHF ₂ | 1.5383 |
| 6-0004 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | O | Me | H | 100-102 |
| 6-0005 | Me | Me | H | H | 0 | H | H | NCHF ₂ | -(CH ₂) ₄ - | | 1.5264 |

【0390】

* * 【表141】

【0391】

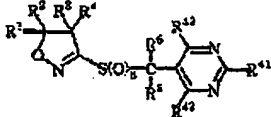
【表142】

(170)

特開2002-308857

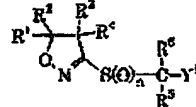
337

338

|  | | | | | | | | | | | |
|---|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|--------------------|----------------|-----------------|---|
| 化合物 番号 | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | R ⁹ | 融点(℃)又は 屈折率(n _D ²⁰) |
| 8-0001 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OMe | CF ₃ | 175-176 |
| 8-0002 | Me | Me | H | H | 0 | H | H | H | OMe | CF ₃ | |
| 8-0003 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | Cl | Cl | 119-120 |
| 8-0004 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OEt | CF ₃ | 94-95 |
| 8-0005 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | H | OMe | OMe | 186-187 |
| 8-0006 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | Me | OMe | CF ₃ | 143-144 |
| 8-0007 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | OMe | OMe | CF ₃ | 144-145 |
| 8-0008 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | SMe | OMe | CF ₃ | 160-162 |
| 8-0009 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | SO ₂ Me | OMe | CF ₃ | 144-146 |
| 8-0010 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | NH ₂ | OMe | CF ₃ | 208-209 |
| 8-0011 | Me | Me | H | H | 2 | Pr-i | H | H | H | CF ₃ | 112-113 |
| 8-0012 | Me | Me | H | H | 0 | Pr-i | H | H | H | CF ₃ | 1.4986 |

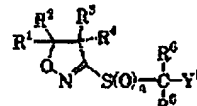
【0392】

* * 【表143】

|  | | | | | | | | | | | |
|---|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|-------------------------------|--|--|---|
| 化合物 番号 | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | Y ¹ | | | 融点(℃)又は 屈折率(n _D ²⁰) |
| 9-0001 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | Pyridin-2-yl | | | 116-118 |
| 9-0002 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | Pyridin-2-yl 1-oxide | | | 140-143 |
| 9-0003 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | Pyridin-4-yl | | | 133-136 |
| 9-0004 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | Pyridin-4-yl 1-oxide | | | 110-113 |
| 9-0005 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | 1,2,4-Oxadiazol-3-yl | | | 測定不可 |
| 9-0006 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | 3-Phenyl-1,2,4-oxadiazol-5-yl | | | 153-154 |
| 9-0007 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | 3-Benzyl-1,2,4-oxadiazol-5-yl | | | 108-109 |
| 9-0008 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | 2-Chlorothiazol-4-yl | | | 110-112 |
| 9-0009 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | 1,4-Dimethylimidazol-5-yl | | | 163-164 |
| 9-0010 | Me | Me | H | H | 1 | H | H | Pyridin-2-yl | | | 81-82 |
| 9-0011 | Me | Me | H | H | 1 | H | H | Pyridin-4-yl | | | 94-96 |
| 9-0012 | Me | Me | H | H | 1 | H | H | 1,4-Dimethylimidazol-5-yl | | | 138-140 |
| 9-0013 | Me | Me | H | H | 0 | H | H | 1,4-Dimethylimidazol-5-yl | | | 1.5427 |

【0393】

【表144】

|  | | | | | | | | | |
|---|----------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|----------------|------------------------------|---|
| 化合物 番号 | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | n | R ⁵ | R ⁶ | Y ¹ | 融点(℃)又は 屈折率(n _D ²⁰) |
| 10-0001 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | Benzimidazol-2-yl | 171-174 |
| 10-0002 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | Benzo[thiophen-2-yl] | 181-183 |
| 10-0003 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | 3-Chlorobenzo[thiophen-2-yl] | 109-112 |
| 10-0004 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | Benzo[triazol-1-yl] | 206-207 |
| 10-0005 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | 1-Methylindazol-4-yl | 128-130 |
| 10-0006 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | Benzo[thiazol-2-yl] | 142-143 |
| 10-0007 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | Benzo[thiophen-3-yl] | 188-191 |
| 10-0008 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | 5-Chlorobenzo[thiophen-3-yl] | 129-130 |
| 10-0009 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | Benzo[xazol-2-yl] | 127-129 |
| 10-0010 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | 3-Methylbenzo[thiophen-2-yl] | 161-163 |
| 10-0011 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | 3-Bromobenzo[thiophen-2-yl] | 118-119 |
| 10-0012 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | Benzo[furan-2-yl] | 123-124 |
| 10-0013 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | 2-Methylbenzo[furan-7-yl] | 135-137 |
| 10-0014 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | 3-Bromobenzo[furan-2-yl] | 107-108 |
| 10-0015 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | Benzo[thiophen-7-yl] | 95-97 |
| 10-0016 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | 1-Methylindazol-7-yl | 89-90 |
| 10-0017 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | 3-Methylbenzo[furan-2-yl] | 111-112 |
| 10-0018 | Me | Me | H | H | 2 | H | H | 3-Chloro-1-methylindol-2-yl | 162-165 |

【0394】(中間体の製造例)

<参考例1>

3-クロロ-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン
の製造

グリオキシル酸アルドオキシム182.7g(2.05モル)の1,2-ジメトキシエタン2l溶液に、65~70℃でN-クロロコハク酸イミド534.0g(4.0モル)を徐々に加えた後、1時間加熱還流した。氷冷下、炭酸水素カリウム1440.0g(14.4モル)及び水10mlを加えた後、2-メチルプロペン360.0g(6.4モル)を反応溶液に加え、室温で24時間攪拌した。反応溶液を水中に注ぎジイソプロピルエーテルで抽出した。得られた有機層を水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、黄色粘調性液体の3-クロロ-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン107.7g(収率40.0%)を得た。

¹H-NMR値(CDCl₃/TMS δ(ppm)):2.93(2H,s), 1.47(6H,s)

【0395】<参考例2>

3-クロロ-5-エチル-5-メチル-2-イソオキサゾリンの製造

グリオキシル酸アルドオキシム20.6g(231.7ミリモル)の1,2-ジメトキシエタン500ml溶液

に、60℃でN-クロロコハク酸イミド61.9g(463.4ミリモル)を徐々に加えた。加え終わった後、10分間加熱還流した。次に、氷冷下、2-メチル-1-ブテン50ml(463.4ミリモル)、炭酸水素カリウム98.9g(1622ミリモル)及び水10mlを加え12時間攪拌した。反応溶液を水中に注ぎn-ヘキサンで抽出した。得られた有機層を水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、淡黄色粘調性液体の3-クロロ-5-エチル-5-メチル-2-イソオキサゾリン13.9g(収率40.6%)を得た。

¹H-NMR値(CDCl₃/TMS δ(ppm)):2.91(2H,ABq,J=17.0,Δν=46.1Hz), 1.73(2H,q), 1.42(3H,s), 0.96(3H,t)

【0396】<参考例3>

3-ベンジルチオ-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリンの製造

ベンジルメルカプタン2.8g(22.5ミリモル)のN,N-ジメチルホルムアミド50ml溶液に、窒素気流下、無水炭酸カリウム3.2g(23.2ミリモル)及び3-クロロ-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン3.0g(22.5ミリモル)を加え100℃で2時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶

(172)

特開2002-308857

341

媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、黄色油状物質（屈折率 $n_D^{20}=1.5521$ ）の3-ベンジルチオ-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン3.1g（収率62.0%）を得た。

$^1\text{H-NMR}$ 値（ CDCl_3/TMS δ (ppm)）：7.24-7.39(5H,m), 4.26(2H,s), 2.77(2H,s), 1.40(6H,s)

【0397】＜参考例4＞

3-(2,6-ジフルオロベンジルスルフィニル)-5-エチル-5-メチル-2-イソオキサゾリンの製造
3-(2,6-ジフルオロベンジルチオ)-5-エチル-5-メチル-2-イソオキサゾリン4.1g（15.0ミリモル）のクロロホルム50ml溶液に、氷冷下、m-クロロ過安息香酸4.6g（純度70%、18.8ミリモル）を加え1時間攪拌した。その後、さらに室温で12時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、炭酸カリウム水溶液、水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒：ヘキサン-酢酸エチル混合溶媒）で精製し、白色粉末（融点30℃以下）の3-(2,6-ジフルオロベンジルスルフィニル)-5-エチル-5-メチル-2-イソオキサゾリン1.5g（収率34.8%）を得た。

$^1\text{H-NMR}$ 値（ CDCl_3/TMS δ (ppm)）：7.39-7.28(1H,m), 7.03-6.94(2H,m), 4.38(2H,s), 3.04(1H,ABq, $J=17.2, \Delta\nu=85.7\text{Hz}$)+3.12(1H,s), 1.75(2H,m), 1.44(3H,s)+1.41(3H,s), 0.97(3H,m)

【0398】＜参考例5＞

3-(2,6-ジフルオロベンジルスルホニル)-5-エチル-5-メチル-2-イソオキサゾリンの製造
3-(2,6-ジフルオロベンジルスルフィニル)-5-エチル-5-メチル-2-イソオキサゾリン0.8g（2.8ミリモル）のクロロホルム50ml溶液に、氷冷下、m-クロロ過安息香酸1.0g（純度70%、4.1ミリモル）を加え1時間攪拌した。その後、さらに室温で12時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、炭酸カリウム水溶液、水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒：ヘキサン-酢酸エチル混合溶媒）で精製し、白色粉末（融点64～65℃）の3-(2,6-ジフルオロベンジルスルホニル)-5-エチル-5-メチル-2-イソオキサゾリン0.6g（収率75.0%）を得た。

$^1\text{H-NMR}$ 値（ CDCl_3/TMS δ (ppm)）：7.36-7.45(1H,m), 6.98-7.04(2H,m), 4.73(2H,s), 3.04(2H,ABq, $J=17.2, \Delta\nu=51.1\text{Hz}$), 1.77(2H,q), 1.46(3H,s), 0.97(3H,t)

【0399】＜参考例6＞

342

5,5-ジメチル-3-メチルスルホニル-2-イソオキサゾリンの製造

3-クロロ-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン143.0g（1.07モル）のN,N-ジメチルホルムアミド500ml溶液に、氷冷下、メチルメルカプタンナトリウム水溶液1.0kg（含量15%、2.14モル）を滴下し、その後室温で12時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、5,5-ジメチル-3-メチルチオ-2-イソオキサゾリンを115.0g（収率74.1%）得た。この抽出物（741.2ミリモル）をクロロホルム1lに溶解し、氷冷下、m-クロロ過安息香酸392.0g（純度70%、1.59モル）を加え1時間攪拌した。その後、さらに室温で12時間攪拌した。反応終了後、析出したm-クロロ安息香酸を濾別し、濾液を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、水、炭酸水素ナトリウム水溶液及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をジイソプロピルエーテルで洗浄し、白色粉末（融点82～84℃）の5,5-ジメチル-3-メチルスルホニル-2-イソオキサゾリン77.6g（収率59.1%）を得た。

$^1\text{H-NMR}$ 値（ CDCl_3/TMS δ (ppm)）：3.26(3H,s), 3.12(2H,s), 1.51(6H,s)

＜参考例7＞

5,5-ジメチル-3-エチルチオ-2-イソオキサゾリンの製造

3-クロロ-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリンを含有した反応溶液に、エチルメルカプタン560.0g（9.0モル）および水酸化ナトリウム360.0g（9.0モル）の水溶液1500mlを加えた。その後、60～70℃で16時間攪拌した。反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水および食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、濃赤色油状の5,5-ジメチル-3-エチルチオ-2-イソオキサゾリンの粗化合物270.0g得た。

【0400】＜参考例8＞

5,5-ジメチル-3-エチルスルホニル-2-イソオキサゾリンの製造

5,5-ジメチル-3-エチルチオ-2-イソオキサゾリンの粗油状物270.0g（1.7モル）をクロロホルム1.0lに溶解し、氷冷下、m-クロロ過安息香酸1050g（純度70%、6.1モル）を加え1時間攪拌し、その後、さらに室温で12時間攪拌した。反応終了確認後、析出したm-クロロ安息香酸を濾別し、濾液を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム水溶液、水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をn-ヘキ

(173)

特開2002-308857

343

ザンで洗浄し、白色粉末の5,5-ジメチル-3-エチルスルホニル-2-イソオキサゾリン133.6g(収率65.4%)を得た。

【0401】<参考例9>

1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-オールの製造

トリフルオロアセト酢酸エチルエステル34.1g(184.9ミリモル)のエタノール500ml溶液にフェニルヒドラジン20g(184.9ミリモル)及び濃塩酸4mlを加えた後、1時間加熱還流した。反応終了後、減圧下溶媒を大部分留去し、残渣に水を加えて結晶を析出させた。ろ過し、得られた結晶をろ液が中性になるまで水で洗浄した後、乾燥して、黄白色結晶の1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-オール37.1g(収率87.9%)を得た。

(¹H-NMR値(CDCl₃/TMS δ(ppm)): 7.68-7.41(5H, m), 5.86(1H, s), 3.71(1H, s)

【0402】<参考例10>

5-クロロ-1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-カルボアルデヒドの製造

N,N-ジメチルホルムアミド7.7g(105.2ミリモル)に、氷冷下、オキシ塩化リン33.6g(219.1ミリモル)を加えた。次に、室温で1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-オール20g(87.7ミリモル)を加えた後、1時間加熱還流した。反応終了後、氷冷下、反応溶液を水中に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層を炭酸水素ナトリウム水溶液及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサン-酢酸エチル混合溶媒)で精製し、白色結晶の5-クロロ-1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-カルボアルデヒド19.1g(収率79.1%)を得た。

(¹H-NMR値(CDCl₃/TMS δ(ppm)): 10.06(1H, s), 7.57(5H, s)

【0403】<参考例11>

(5-クロロ-1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イル)-メタノールの製造

水素化リチウムアルミニウム0.21g(5.5ミリモル)のTHF70ml溶液を-30℃に冷却し、5-クロロ-1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-カルボアルデヒド3g(10.9ミリモル)のテトラヒドロフラン30ml溶液を徐々に加えた。さらに-30℃で30分間攪拌した。反応終了後、酢酸エチルを加えて攪拌した後、水を加え、しばらく攪拌した。この反応混合物を減圧ろ過し、ろ液を酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、白色結晶の(5-クロロ-1-フェニル-3-トリフルオ

344

ロメチル-1H-ピラゾール-4-イル)-メタノール3.0g(収率99.9%)を得た。

(¹H-NMR値(CDCl₃/TMS δ(ppm)): 7.54-7.51(5H, m), 4.71(2H, d), 1.79(1H, b)

【0404】<参考例12>

4-ブロモメチル-5-クロロ-1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾールの製造

(5-クロロ-1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イル)-メタノール3.0g(10.9ミリモル)のジエチルエーテル60ml溶液を-10℃に冷却し、三臭化リン1.0g(3.8ミリモル)を加え、さらに室温で1時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、白色結晶の4-ブロモメチル-1H-ピラゾール3.6g(収率95.8%)を得た。

(¹H-NMR値(CDCl₃/TMS δ(ppm)): 7.58-7.48(5H, m), 4.48(2H, s)

【0405】<参考例13>

5-フルオロ-1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-カルボアルデヒドの製造

5-クロロ-1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-カルボアルデヒド33.0g(120.1ミリモル)のジメチルスルホキシド500ml溶液に、ぶっ化カリウム10.5g(180.2ミリモル)を加え、100℃で2時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサン-酢酸エチル混合溶媒)で精製し、5-フルオロ-1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-カルボアルデヒド26.5g(収率85.0%)を得た。

(¹H-NMR値(CDCl₃/TMS δ(ppm)): 9.96(1H, s), 7.68-7.51(5H, m)

【0406】<参考例14>

(5-フルオロ-1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イル)-メタノールの製造

水素化ホウ素ナトリウム1.6g(41.0ミリモル)のメタノール300ml溶液に、氷冷下、5-フルオロ-1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-カルボアルデヒド26.5g(102.5ミリモル)のメタノール200ml溶液を加え、0℃で30分間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、(5-フルオロ-1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イル)-メタノール

(174)

特開2002-308857

345

28.5 g (収率100%)を得た。

(¹H-NMR値 (CDCl₃/TMS δ(ppm)) : 7.65-7.41(5H, m), 4.68(2H, d), 1.73(1H, t)

【0407】<参考例15>

4-ブロモメチル-5-フルオロ-1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾールの製造

(5-フルオロ-1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イル)-メタノール27.5 g(105.7ミリモル)のジエチルエーテル300ml溶液を0℃に冷却し、三臭化リン10.0 g(37.0ミリモル)を加え、さらに室温で2時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎジエチルエーテルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、4-ブロモメチル-5-フルオロ-1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール30.3 g(収率88.8%)を得た。

(¹H-NMR値 (CDCl₃/TMS δ(ppm)) : 7.66-7.42(5H, m), 4.44(2H, s)

【0408】<参考例16>

1-tert-ブチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-オールの製造

トリフルオロアセト酢酸エチルエステル552.3 g(3.0モル)のエタノール1500ml溶液にtert-ブチルヒドラジン塩酸塩373.8 g(3.0モル)及び濃塩酸50mlを加えた後、2日間加熱還流した。反応終了後、減圧下溶媒を大部分留去し、残渣を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をn-ヘキサンで洗浄し、白色粉末の1-tert-ブチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-オール369.0 g(収率59.1%)を得た。

【0409】<参考例17>

1-tert-ブチル-5-クロロ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-カルボアルデヒドの製造

N,N-ジメチルホルムアミド87.7 g(1.2モル)に、氷冷下、オキシ塩化リン462.0 g(3.0モル)を加えた。次に、室温で1-tert-ブチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-オール208.2 g(1.0モル)を加えた後、10時間加熱還流した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層を水、5%水酸化ナトリウム水溶液及び水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒：ヘキサン-酢酸エチル混合溶媒)で精製し、白色結晶の1-tert-ブチル-5-クロロ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-カルボアルデヒド131.5 g(収率21.7%)を得た。

346

(¹H-NMR値 (CDCl₃/TMS δ(ppm)) : 9.97(1H, d), 1.76(9H, s)

【0410】<参考例18>

(1-tert-ブチル-5-クロロ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イル)-メタノールの製造

1-tert-ブチル-5-クロロ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-カルボアルデヒド39.9 g(156.9ミリモル)のメタノール300ml溶液を0℃に冷却し、水酸化ナトリウム6.5 g(172.6ミリモル)を徐々に加え、さらに室温で3時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、(1-tert-ブチル-5-クロロ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イル)-メタノール37.7 g(収率93.6%)を得た。

(¹H-NMR値 (CDCl₃/TMS δ(ppm)) : 4.60(2H, d), 1.72(9H, s), 1.58(1H, t)

20 【0411】<参考例19>

4-ブロモメチル-1-tert-ブチル-5-クロロ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾールの製造

(1-tert-ブチル-5-クロロ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イル)-メタノール9.2 g(35.7ミリモル)のジエチルエーテル100ml溶液を-10℃に冷却し、三臭化リン11.6 g(42.9ミリモル)を加え、さらに室温で一晩攪拌した。反応終了後、反応溶液を氷水中に注ぎジエチルエーテルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、4-ブロモメチル-1-tert-ブチル-5-クロロ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール10.0 g(収率87.3%)を得た。

【0412】<参考例20>

(1-tert-ブチル-5-クロロ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イル)-メタンチオールの製造

水酸化ナトリウム水和物21.8 g(純度70%、272.2ミリモル)のN,N-ジメチルホルムアミド300ml溶液に4-ブロモメチル-1-tert-ブチル-5-クロロ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール43.5 g(136.1ミリモル)を加え、さらに室温で一晩攪拌した。反応終了後、反応溶液を氷水中に注ぎジエチルエーテルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、(1-tert-ブチル-5-クロロ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イル)-メタンチオール32.3 g(収率87.0%)を得た。

(¹H-NMR値 (CDCl₃/TMS δ(ppm)) : 3.65(2H, d), 1.90(1H, t), 1.70(9H, s)

50

(175)

特開2002-308857

347

【0413】＜参考例21＞

1-tert-ブチル-5-メトキシ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾールの製造

1-tert-ブチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-オール18.8g(90.3ミリモル)のN,N-ジメチルホルムアミド100ml溶液に、室温で無水炭酸カリウム15.0g(108.4ミリモル)及びヨウ化メチル19.3g(135.5ミリモル)を加え、さらに15時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎジエチルエーテルで抽出した。得られた有機層を水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、1-tert-ブチル-5-メトキシ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール20.0g(収率99.8%)を得た。

【0414】＜参考例22＞

1-tert-ブチル-4-クロロメチル-5-メトキシ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾールの製造

1-tert-ブチル-5-メトキシ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール20.0g(90.1ミリモル)の酢酸90ml溶液に、パラホルムアルデヒド5.4g(ホルムアルデヒド換算180.2ミリモル)及び濃塩酸20mlを加え60℃で30分間加熱攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎジイソプロピルエーテルで抽出した。得られた有機層を水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、1-tert-ブチル-4-クロロメチル-5-メトキシ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール21.7g(収率89.0%)を得た。

【0415】＜参考例23＞

3-メトキシ-1-メチル-5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾールの製造

3-ヒドロキシ-1-メチル-5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール10.0g(60.2ミリモル)のN,N-ジメチルホルムアミド50ml溶液に、室温で無水炭酸カリウム10.0g(72.3ミリモル)及びヨウ化メチル12.8g(90.3ミリモル)を加え、さらに15時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎジエチルエーテルで抽出した。得られた有機層を水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、3-メトキシ-1-メチル-5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール9.8g(収率90.7%)を得た。

【0416】＜参考例24＞

4-クロロメチル-3-メトキシ-1-メチル-5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾールの製造

3-メトキシ-1-メチル-5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール10.0g(5.6ミリモル)の酢酸25ml溶液に、パラホルムアルデヒド0.45g(ホルムアルデヒド換算15.0ミリモル)及び濃塩酸5mlを加え80℃で2時間加熱攪拌した。反応終了後、反応溶液を

348

水中に注ぎ炭酸カリウムを用いて中和した後、酢酸エーテルで抽出した。得られた有機層を水洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒：ヘキサン-酢酸エチル混合溶媒)で精製し4-クロロメチル-3-メトキシ-1-メチル-5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール0.83g(収率65.0%)を得た。

【0417】＜参考例25＞

5-フルオロ-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-カルボアルデヒドの製造

5-クロロ-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-カルボアルデヒド60.4g(282.7ミリモル)のジメチルスルホキシド700ml溶液に、ふっ化カリウム42.0g(711.9ミリモル)を加え、120～140℃で5時間攪拌した。反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎ酢酸エーテルで抽出した。得られた有機層を水および食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒：ヘキサン-酢酸エチル混合溶媒)で精製し、5-フルオロ-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-36.8g(収率66.0%)を得た。

【0418】＜参考例26＞

(5-フルオロ-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イル)-メタノールの製造

水素化ホウ素ナトリウム3.9g(102.6ミリモル)のメタノール500mlに溶液、氷冷下、5-フルオロ-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-カルボアルデヒド36.8g(187.6ミリモル)のメタノール200ml溶液を加えた。0℃で30分間攪拌した。反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎ酢酸エーテルで抽出した。得られた有機層を水および食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、(5-フルオロ-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イル)-メタノール35.4g(収率95.4%)を得た。

【0419】＜参考例27＞

4-ブロモメチル-5-フルオロ-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾールの製造

5-フルオロ-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-カルボアルデヒド35.4g(178.7ミリモル)のジエチルエーテル500ml溶液を-30℃に冷却し、三臭化りん54.0g(199.5ミリモル)を加えた。室温で12時間攪拌した。反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎジエチルエーテルで抽出した。得られた有機層を水及び食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、4-ブロモメチル-5-フルオロ-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール31.4g(収率8

(176)

特開2002-308857

349

0.8%)を得た。

【0420】<参考例28>

(エトキシカルボニル)マロンジアルデヒドの製造

水素化ナトリウム12.6g(純度60%, 525.0ミリモル)をジエチルエーテルで数回デカントした後、ジエチルエーテル500ml溶液とした。そして、窒素気流下、0~10℃で、ギ酸エチル194g(2.6モル)および3,3-ジエトキシプロピオン酸エチルエステル50g(262.0ミリモル)を加えた。その後、室温で15時間攪拌し、反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎ、ジエチルエーテルで洗浄した。得られた水層を塩酸でpH1とした後、ジクロロメタンで抽出した。更に、得られた有機層を食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、淡黄色油状の(エトキシカルボニル)マロンジアルデヒドの粗化合物37.6g(収率100%)を得た。

(¹H-NMR値(CDCl₃/TMS δ(ppm)) : 9.09(2H, s), 5.26(1H, s), 4.27(2H, q), 1.28(3H, t)

【0421】<参考例29>

1H-ピラゾール-4-カルボン酸エチルエステルの製造

(エトキシカルボニル)マロンジアルデヒド27.6g(192ミリモル)のエタノール150ml溶液に氷冷下、ヒドラジン6.2g(193ミリモル)を加え、室温で17時間攪拌した。その後、減圧下エタノールを留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒: ジクロロメタン-酢酸エチル混合溶媒)で精製し、黄色結晶の1H-ピラゾール-4-カルボン酸エチルエステル19.4g(72.4%)を得た。

(¹H-NMR値(CDCl₃/TMS δ(ppm)) : 8.08(2H, s), 5.30(1H, s), 4.31(2H, q), 1.36(3H, t)

【0422】<参考例30>

1-エチル-1H-ピラゾール-4-カルボン酸エチルエステルの製造

1H-ピラゾール-4-カルボン酸エチルエステル1.5g(10.7ミリモル)のN,N-ジメチルホルムアミド50ml溶液に無水炭酸カリウム3.7g(26.8ミリモル)、ヨウ化エチル4.2g(26.6ミリモル)を加え、室温で20時間攪拌した。反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水および食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒: ヘキサン-酢酸エチル混合溶媒)で精製し、黄色油状物の1-エチル-1H-ピラゾール-4-カルボン酸エチルエステル1.6g(収率88.9%)を得た。

(¹H-NMR値(CDCl₃/TMS δ(ppm)) : 7.90(2H, s), 4.28(2H, q), 4.18(2H, q), 1.51(3H, t), 1.35(3H, t)

【0423】<参考例31>

3,5-ジクロロ-1-エチル-1H-ピラゾール-4

10

350

-カルボン酸エチルエステルの製造

1-エチル-1H-ピラゾール-4-カルボン酸エチルエステル1.6g(9.5ミリモル)、N-クロロコハク酸イミド5.1g(38.3ミリモル)をガラス封管に入れ、160℃で6時間反応させた。反応終了後、室温まで冷却し、反応物を四塩化炭素およびクロロホルムで洗浄、減圧ろ過した。得られたろ液(有機層)を水および食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒: ヘキサン-酢酸エチル混合溶媒)で精製し、黄色油状物の3,5-ジクロロ-1-エチル-1H-ピラゾール-4-カルボン酸エチルエステル1.0g(収率44.2%)を得た。

(¹H-NMR値(CDCl₃/TMS δ(ppm)) : 4.36(2H, q), 4.21(2H, q), 1.44(3H, t), 1.38(3H, t)

【0424】<参考例32>

(3,5-ジクロロ-1-エチル-1H-ピラゾール-4-イル)メタノールの製造

水素化リチウムアルミニウム0.16g(4.2ミリモル)のテトラヒドロフラン70ml溶液を-50℃に冷却し、3,5-ジクロロ-1-エチル-1H-ピラゾール-4-カルボン酸エチルエステル1.0g(4.2ミリモル)のテトラヒドロフラン30ml溶液をゆっくり滴下し、更に-50℃で3時間攪拌した。反応終了確認後、酢酸エチルを加えて、しばらく攪拌した後、更に水を加え、しばらく攪拌した。減圧ろ過し、ろ液を酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水および食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、茶色油状物の(3,5-ジクロロ-1-エチル-1H-ピラゾール-4-イル)メタノール0.82g(収率100%)を得た。

(¹H-NMR値(CDCl₃/TMS δ(ppm)) : 4.52(2H, s), 4.16(2H, q), 1.43(3H, t)

【0425】<参考例33>

4-プロモメチル-3,5-ジクロロ-1-エチル-1H-ピラゾールの製造

(3,5-ジクロロ-1-エチル-1H-ピラゾール-4-イル)メタノール0.82g(4.2ミリモル)のジエチルエーテル50ml溶液を-30℃に冷却し、三臭化リン1.3g(4.8ミリモル)を加え、更に室温で12時間攪拌した。反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水および食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、黄色油状物の4-プロモメチル-3,5-ジクロロ-1-エチル-1H-ピラゾール0.9g(収率81.8%)を得た。

(¹H-NMR値(CDCl₃/TMS δ(ppm)) : 4.33(2H, s), 4.13(2H, q), 1.43(3H, t)

【0426】<参考例34>

3-ジフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール

50

(177)

特開2002-308857

351

-5-オール製造

ジフルオロアセト酢酸エチルエステル30.0g(180.6ミリモル)のエタノール200ml溶液にメチルヒドラジン8.3g(180.6ミリモル)及び濃塩酸5mlを加えた後、2日間加熱還流した。反応終了後、減圧下溶媒を大部分留去した。残渣を水中に注ぎクエン酸でpH4とした後、酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサン-酢酸エチル混合溶媒)で精製し、3-ジフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-5-オール8.9g(収率33.3%)を得た。

【0427】<参考例35>

5-クロロ-3-ジフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボアルデヒドの製造

N,N-ジメチルホルムアミド7.9g(108.0ミリモル)に、氷冷下、オキシ塩化リン41.6g(270.1ミリモル)を加えた。次に、室温で3-ジフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-5-オール8.0g(54.0ミリモル)を加えた後、4時間加熱還流した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎクロホルムで抽出した。得られた有機層を水、5%水酸化ナトリウム水溶液及び水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサン-酢酸エチル混合溶媒)で精製し、白色結晶の5-クロロ-3-ジフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボアルデヒド7.7g(収率73.3%)を得た。

(¹H-NMR値(CDCl₃/TMS δ(ppm)): 9.96(1H,s), 6.90(1H,t, J=53.6Hz), 3.93(3H,s)

【0428】<参考例36>

(5-クロロ-3-ジフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル)-メタノールの製造

5-クロロ-3-ジフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボアルデヒド7.2g(37.0ミリモル)のメタノール100ml溶液を0℃に冷却し、水素化ホウ素ナトリウム2.1g(55.5ミリモル)を徐々に加え、さらに室温で3時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、(5-クロロ-3-ジフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル)-メタノール3.8g(収率52.1%)を得た。

(¹H-NMR値(CDCl₃/TMS δ(ppm)): 6.70(1H,t, J=40.8Hz), 4.63(2H,s), 3.86(3H,s), 1.79(1H,br)

【0429】<参考例37>

4-ブロモメチル-5-クロロ-3-ジフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾールの製造

352

(5-クロロ-3-ジフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル)-メタノール2.0g(10.0ミリモル)のジエチルエーテル50ml溶液を-10℃に冷却し、三氯化リン1.0g(3.5ミリモル)を加え、さらに室温で一晩攪拌した。反応終了後、反応溶液を氷水中に注ぎジエチルエーテルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、4-ブロモメチル-5-クロロ-3-ジフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール2.6g(収率100.0%)を得た。

【0430】<参考例38>

トリフルオロアセトアルデヒドオキシムエーテールの製造

トリフルオロアセトアルデヒドヘミエチルアセタール50.0g(347.0ミリモル)のメタノール80ml溶液に、ヒドロキシルアミン塩酸塩24.1g(347.0ミリモル)、水160mlを加え、氷冷下、50%水酸化ナトリウム水溶液80.0g(1.7モル)を滴下した。滴下終了後室温で6時間攪拌した。反応終了後、10%塩酸を加えてpH6とし、ジエチルエーテルで抽出した。減圧下溶媒を留去し、残渣を蒸留し、トリフルオロアセトアルデヒドオキシムエーテール24.7g(収率38.0%)を得た。

【0431】<参考例39>

トリフルオロアセトヒドロキシモイルプロミドエーテールの製造

トリフルオロアセトアルデヒドオキシムエーテール24.7g(131.7ミリモル)のN,N-ジメチルホルムアミド50ml溶液に、氷冷下、N-プロモこほく酸イミド38.8g(218.0ミリモル)のN,N-ジメチルホルムアミド125ml溶液を加え、室温で3時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎジエチルエーテルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣を蒸留し、褐色油状物質のトリフルオロアセトヒドロキシモイルプロミドエーテール33.3g(収率95.0%)を得た。

(¹H-NMR値(CDCl₃/TMS δ(ppm)): 9.30(1H, s)

【0432】<参考例40>

4-エトキシカルボニル-5-メチル-3-トリフルオロメチルイソキサゾールの製造

アセト酢酸エチル6.7g(51.3ミリモル)のメタノール80ml溶液に、ナトリウムメトキシド2.8g(51.3ミリモル)を加え、氷冷下、トリフルオロアセトヒドロキシモイルプロミドエーテール5.0g(18.8ミリモル)のメタノール20ml溶液を加えた。室温で3時間攪拌した。反応終了後、減圧下溶媒を留去し、水を加え、クロホルムで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカ

(178)

特開2002-308857

353

ムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサン-酢酸エチル混合溶媒)で精製し、無色油状物質の4-エトキシカルボニル-5-メチル-3-トリフルオロメチルイソキサゾール2.9g(収率69.0%)を得た。

(¹H-NMR値(CDCl₃/TMS δ(ppm)): 4.36(2H, q), 2.77(3H, s), 1.37(3H, t)

[0433]<参考例41>

(5-メチル-3-トリフルオロメチルイソキサゾール-4-イル)-メタノールの製造

水素化リチウムアルミニウム0.16g(4.2ミリモル)のTHF15ml溶液を0℃に冷却し、4-エトキシカルボニル-5-メチル-3-トリフルオロメチルイソキサゾール0.93g(4.2ミリモル)のTHF15ml溶液を徐々に加えた。0℃で1時間攪拌した。反応終了後、酢酸エチルを加えてしばらく攪拌した後、水を加え、しばらく攪拌した。減圧ろ過し、ろ液をジエチルエーテルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、(5-メチル-3-トリフルオロメチルイソキサゾール-4-イル)-メタノール0.5g(収率60.0%)を得た。

(¹H-NMR値(CDCl₃/TMS δ(ppm)): 4.60(2H, d), 2.54(3H, s), 1.56(1H, br)

[0434]<参考例42>

4-ブロモメチル-5-メチル-3-トリフルオロメチルイソキサゾールの製造

(5-メチル-3-トリフルオロメチルイソキサゾール-4-イル)-メタノール0.45g(2.5ミリモル)のジエチルエーテル10ml溶液を0℃に冷却し、三臭化りん0.2g(8.9ミリモル)を加えた。室温で1時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎジエチルエーテルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、4-ブロモメチル-5-メチル-3-トリフルオロメチルイソキサゾール0.5g(収率74.0%)を得た。

(¹H-NMR値(CDCl₃/TMS δ(ppm)): 4.31(2H, d), 2.51(3H, s)

[0435]<参考例43>

(5-クロロ-3-メチル-イソチアゾール-4-イル)-メタノールの製造

水素化リチウムアルミニウム0.42g(11.0ミリモル)のTHF10ml溶液に、-30℃で5-クロロ-3-メチル-イソチアゾール-4-カルボン酸エチルエステル2.06g(10.0ミリモル)のTHF10ml溶液を滴下し、さらに同温度で1時間攪拌した。反応終了確認後、反応溶液に酢酸エチルを加えた後、水中にかけ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロ

354

マトグラフィーで精製し、(5-クロロ-3-メチル-イソチアゾール-4-イル)-メタノール1.50g(収率91.5%)を得た。

[0436]<参考例44>

4-クロロメチル-5-クロロ-3-メチルイソチアゾールの製造

(5-クロロ-3-メチル-イソチアゾール-4-イル)-メタノール1.50g(9.15ミリモル)のクロロホルム10ml溶液に、室温で塩化チオニル3.26g(27.44ミリモル)を加え3時間攪拌した。反応終了確認後、減圧下溶媒を留去し、4-クロロメチル-5-クロロ-3-メチルイソチアゾール1.67g(収率定量的)を得た。

[0437]<参考例45>

4-トリフルオロメチルニコチン酸メチルエステルの製造

4-トリフルオロメチルニコチン酸4.6g(24.1ミリモル)のN,N-ジメチルホルムアミド70ml溶液に、無水炭酸カリウム6.7g(48.6ミリモル)、ヨウ化メチル6.9g(48.6ミリモル)を加え、室温で12時間攪拌した。反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水および食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサン-酢酸エチル混合溶媒)で精製し、無色油状物の4-トリフルオロメチルニコチン酸メチルエステル2.77g(収率56.1%)を得た。

(¹H-NMR値(CDCl₃/TMS δ(ppm)): 9.11(1H, s), 8.92(1H, d), 7.64(1H, d), 3.99(3H, s)

[0438]<参考例46>

(4-トリフルオロメチルピリジン-3-イル)-メタノールの製造

水素化リチウムアルミニウム0.37g(9.7ミリモル)のTHF100ml溶液を-50℃に冷却し、4-トリフルオロメチルニコチン酸メチルエステル2.0g(9.8ミリモル)のTHF30ml溶液をゆっくり滴下し、更に-50℃で3時間攪拌した。反応終了確認後、酢酸エチルを加えて、しばらく攪拌した後、更に水を加え、再度しばらく攪拌した。反応混合物を減圧ろ過し、ろ液を酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水および食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサン-酢酸エチル混合溶媒)で精製し、無色油状物の(4-トリフルオロメチルピリジン-3-イル)-メタノール0.6g(収率35.3%)を得た。

(¹H-NMR値(CDCl₃/TMS δ(ppm)): 9.00(1H, s), 8.73(1H, d), 7.51(1H, d), 4.95(2H, s)

[0439]<参考例47>

3-ブロメチル-4-トリフルオロメチルピリジンの

製造

(4-トリフルオロメチルピリジン-3-イル)メタノール 0.6 g (3.4ミリモル)のジエチルエーテル50 ml 溶液を-30℃に冷却し、三臭化リン1.4 g (5.2ミリモル)を加え、更に室温で12時間攪拌した。反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水および食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、黄色油状物の3-ブロモメチル-4-トリフルオロメチルピリジン0.61 g (収率75.3%)を得た。

(¹H-NMR値 (CDCl₃/TMS δ (ppm)) : 8.88(1H,s), 8.73(1H,d), 7.54(1H,d), 4.63(2H,s)

【0440】<参考例48>

5-ブロモ-4-ヒドロキシ-6-トリフルオロメチルピリミジンの製造

4-ヒドロキシ-6-トリフルオロメチルピリミジン49.2 g (300.0ミリモル)の酢酸600 ml 溶液に、室温で無水酢酸ナトリウム77.5 g (945.0ミリモル)を加えた。さらに45℃で反応溶液中に臭素50.3 g (315ミリモル)を徐々に加え、同温度で3時間攪拌した。反応終了確認後、減圧下溶媒を留去した。残渣を水にあげ、酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をn-ヘキサンで洗浄し5-ブロモ-4-ヒドロキシ-6-トリフルオロメチルピリミジン38.9 g (収率53.4%)を得た。

【0441】<参考例49>

5-ブロモ-4-クロロ-6-トリフルオロメチルピリミジンの製造

5-ブロモ-4-ヒドロキシ-6-トリフルオロメチルピリミジン24.3 g (100.0ミリモル)をオキシ塩化リン18.5 g (120.0ミリモル)に懸濁させ、100℃で2時間攪拌した。反応終了確認後、反応溶液を徐々に水にあげクロロホルムで抽出した。得られた有機層を水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、5-ブロモ-4-クロロ-6-トリフルオロメチルピリミジン21.5 g (収率82.4%)を得た。

【0442】<参考例50>

5-ブロモ-4-メトキシ-6-トリフルオロメチルピリミジンの製造

5-ブロモ-4-クロロ-6-トリフルオロメチルピリミジン21.5 g (82.2ミリモル)のメタノール100 ml 溶液に、室温でナトリウムメトキッド16.7 ml (28%メタノール溶液 86.4ミリモル)を加え攪拌した。反応終了確認後、減圧下溶媒を留去した。残渣を水にあげ、クロロホルムで抽出した。得られた有機層を水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をn-ヘキサン

で洗浄し、5-ブロモ-4-メトキシ-6-トリフルオロメチルピリミジン19.2 g (収率91.0%)を得た。

【0443】<参考例51>

5-ブロモ-4-エトキシ-6-トリフルオロメチルピリミジンの製造

5-ブロモ-4-クロロ-6-トリフルオロメチルピリミジン3.00 g (11.48ミリモル)のエタノール50 ml 溶液に、室温でナトリウムエトキッド0.94 g (13.77ミリモル)を加え攪拌した。反応終了確認後、減圧下溶媒を留去した。残渣を水にあげ、クロロホルムで抽出した。得られた有機層を水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し5-ブロモ-4-エトキシ-6-トリフルオロメチルピリミジン2.44 g (収率82.9%)を得た。

【0444】<参考例52>

4-メトキシ-6-トリフルオロメチルピリミジン-5-カルボアルデヒドの製造

5-ブロモ-4-メトキシ-6-トリフルオロメチルピリミジン10.3 g (40.0ミリモル)のテトラヒドロフラン100 ml 溶液に、-65~-60℃でn-ブチルリチウム30.0 ml (1.6 mol/l n-ヘキサン溶液48.0ミリモル)を徐々に加えた後、30分間攪拌した。さらに同温度で、辛酸エチル3.6 g (48.0ミリモル)を加えた後、同温度で3時間攪拌した。反応溶液を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、4-メトキシ-6-トリフルオロメチルピリミジン-5-カルボアルデヒド1.3 g (収率15.8%)を得た。

(¹H-NMR値 (CDCl₃/TMS δ (ppm)) : 10.41(1H,q), 8.98(1H,s), 4.18(3H,s)

【0445】<参考例53>

4-エトキシ-6-トリフルオロメチルピリミジン-5-カルボアルデヒドの製造

5-ブロモ-4-エトキシ-6-トリフルオロメチルピリミジン5.76 g (21.3ミリモル)のTHF250 ml 溶液を-78℃に冷却し、n-ブチルリチウム22.6 ml (1.6 mol/l n-ヘキサン溶液 36.1ミリモル)を滴下し、40分間攪拌した。辛酸メチル2.7 g (45.1ミリモル)を加え、さらに1.5時間攪拌した。反応終了後、塩化アンモニウム水溶液を加え、ジエチルエーテルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒：ヘキサン-酢酸エチル混合溶媒)で精製し、4-エトキシ-6-トリフルオロメチルピリミジン-5-カルボアルデヒド3.82 g (収率81.6%)を得た。

($^1\text{H-NMR}$ 値 (CDCl_3/TMS δ (ppm)) : 10.41(1H, s), 8.95(1H, s), 4.63(2H, q), 1.48(3H, t)

【0446】<参考例54>

(4-メトキシ-6-トリフルオロメチルピリミジン-5-イル)-メタノールの製造

4-メトキシ-6-トリフルオロメチルピリミジン-5-カルボアルデヒド 1.3 g (6.3 ミリモル) のメタノール 30 ml 溶液に、室温で水素化ホウ素ナトリウム 0.24 g (6.3 ミリモル) を徐々に加え 3 時間攪拌した。

反応終了確認後、水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、(4-メトキシ-6-トリフルオロメチルピリミジン-5-イル)-メタノール 0.42 g (収率 32.1%) を得た。

($^1\text{H-NMR}$ 値 (CDCl_3/TMS δ (ppm)) : 8.93(1H, s), 4.81(2H, s), 4.13(3H, s), 2.26(1H, br)

【0447】<参考例55>

(4-エトキシ-6-トリフルオロメチルピリミジン-5-イル)-メタノールの製造

水素化ホウ素ナトリウム 1.7 g (45.7 ミリモル) のメタノール 50 ml 溶液に、氷冷下、4-エトキシ-6-トリフルオロメチルピリミジン-5-カルボアルデヒド 3.82 g (17.2 ミリモル) のメタノール 50 ml 溶液を加え、さらに 0°C で 1 時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、(4-エトキシ-6-トリフルオロメチルピリミジン-5-イル)-メタノール 3.77 g (収率 97.8%) を得た。

($^1\text{H-NMR}$ 値 (CDCl_3/TMS δ (ppm)) : 8.80(1H, s), 4.81(2H, s), 4.59(2H, q), 2.28(1H, b), 1.48(3H, t)

【0448】<参考例56>

5-クロロメチル-4-メトキシ-6-トリフルオロメチルピリミジンの製造

(4-メトキシ-6-トリフルオロメチルピリミジン-5-イル)-メタノール 0.42 g (2.02 ミリモル) のクロロホルム 10 ml 溶液に、室温で塩化チオニル 1.19 g (10.1 ミリモル) を加え 3 時間攪拌した。反応終了確認後、減圧下溶媒を留去し、5-クロロメチル-4-メトキシ-6-トリフルオロメチルピリミジン 0.45 g (収率：定量的) を得た。

【0449】<参考例57>

5-ブロモメチル-4-エトキシ-6-トリフルオロメチルピリミジンの製造

(4-エトキシ-6-トリフルオロメチルピリミジン-5-イル)-メタノール 3.77 g (17.0 ミリモル) のジエチルエーテル 50 ml 溶液を 0°C に冷却し、三臭化りん 2.0 g (7.2 ミリモル) を加えた。室温で 1 時間攪

拌した。生じた塩をメタノールで溶解し、さらに 1 時間攪拌した。反応溶液を水中に注ぎジエチルエーテルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、5-ブロモメチル-4-エトキシ-6-トリフルオロメチルピリミジンの組化合物を得た。

($^1\text{H-NMR}$ 値 (CDCl_3/TMS δ (ppm)) : 8.79(1H, s), 4.61(2H, q), 4.55(2H, s), 1.49(3H, t)

【0450】<参考例58>

4-メトキシ-6-トリフルオロメチルピリミジン-5-カルボアルデヒドの製造

5-ブロモ-4-メトキシ-6-トリフルオロメチルピリミジン 10.3 g (40.0 ミリモル) のテトラヒドロフラン 100 ml 溶液に、-65~-60°C で n-ブチルリチウム (1.6 mol/l / n-ヘキサン溶液) 30.0 ml (48.0 ミリモル) を徐々に加えた後、30 分間攪拌した。さらに同温度で、キ酸エチル 3.6 g (48.0 ミリモル) を加えた後、同温度で 3 時間攪拌した。反応溶液を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、4-メトキシ-6-トリフルオロメチルピリミジン-5-カルボアルデヒド 1.3 g (収率 15.8%) を得た。

($^1\text{H-NMR}$ 値 (CDCl_3/TMS δ (ppm)) : 10.41(1H, q), 8.98(1H, s), 4.18(3H, s)

【0451】<参考例59>

(2-クロロ-4-メチルピリジン-3-イル)メタノールの製造

水素化リチウムアルミニウム 0.4 g (10.0 ミリモル) のテトラヒドロフラン 30 ml 懸濁液に、-65~-60°C でメチル 2-クロロ-4-メチルニコチン酸 1.9 g (10.0 ミリモル) の THF 5.0 ml 溶液を徐々に加えた後、30 分間攪拌した。さらに -20°C で、1 時間攪拌した。反応溶液を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、(2-クロロ-4-メチルピリジン-3-イル)メタノール 0.6 g (収率 38.2%) を得た。

($^1\text{H-NMR}$ 値 (CDCl_3/TMS δ (ppm)) : 8.19(1H, d), 7.08(1H, d), 4.85(2H, s), 2.49(3H, s)

【0452】<参考例60>

3-アセチル-4-クロロメチル-2,5-ジクロロチオフェンの製造

3-アセチル-2,5-ジクロロチオフェン 5.0 g (32.4 ミリモル) のクロロメチルメチルエーテル 26 ml (323.0 ミリモル) 溶液に、氷冷下 10°C で四塩化チタン (2 mol/l / ジクロロメタン溶液) 33 ml (66.0 ミリモル) を滴下した。その後室温で 2 時間攪拌し

た。反応終了後、反応溶液を氷水中に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層を重曹及び水、食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサン/酢酸エチル=9/1)で精製し、黄色結晶の3-アセチル-4-クロロメチル-2,5-ジクロロチオフェン2.6g(収率39.7%)を得た。

(¹H-NMR値(CDCl₃/TMS δ(ppm)): 4.70(2H, s), 2.56(3H, s), 2.54(3H, s), 2.39(3H, s)

【0453】<参考例61>

3-ブロモ-2-ブロモメチルベンゾフランの製造
3-ブロモ-2-メチルベンゾフラン2.8g(13.3ミリモル)のモノクロロベンゼン30ml溶液に、N-ブロモコハク酸イミド2.7g(15.3ミリモル)及びアゾビスイソブチロニトリル0.4g(2.7ミリモル)を加えた後、80℃で30分間攪拌した。原料消失を確認した後、反応溶液を室温にまで冷却した。不溶物を濾別し、濾液を減圧下溶媒を留去した。残渣を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、3-ブロモ-2-ブロモメチルベンゾフラン3.0g(収率79.0%)を得た。

【0454】<参考例62>

1-ジフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-カルボン酸エチルエステルの製造

1H-ピラゾール-4-カルボン酸エチルエステル3.0g(21.4ミリモル)のN,N-ジメチルホルムアミド100ml溶液に、無水炭酸カリウム6.0g(43.5ミリモル)を加え、クロロジフルオロメタンを反応溶液に吹き込み、130~140℃で3時間攪拌した。反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水および食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサン-酢酸エチル混合溶媒)で精製し、無色透明油状物の1-ジフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-カルボン酸エチルエステル1.67g(収率41.0%)を得た。

(¹H-NMR値(CDCl₃/TMS δ(ppm)): 8.32(1H, s), 8.04(1H, s), 7.29(1H, t), 4.32(2H, q), 1.37(3H, t)

本発明の除草剤は、一般式【I】で示されるイソオキサゾリン誘導体及これを有効成分とする。

【0455】本発明化合物を除草剤として使用するには本発明化合物それ自体で用いてもよいが、製剤化に一般的に用いられる担体、界面活性剤、分散剤または補助剤等を配合して、粉剤、水和剤、乳剤、フロアブル剤、微粒剤または粒剤等に製剤して使用することもできる。

【0456】製剤化に際して用いられる担体としては、例えばタルク、ベントナイト、クレー、カオリン、珪藻

土、ホワイトカーボン、バーミキュライト、炭酸カルシウム、消石灰、珪砂、硫安、尿素等の固体担体、イソプロピルアルコール、キシレン、シクロヘキサン、メチルナフタレン等の液体担体等があげられる。

【0457】界面活性剤及び分散剤としては、例えばアルキルベンゼンスルホン酸金属塩、ジナフチルメタンジスルホン酸金属塩、アルコール硫酸エステル塩、アルキルアリールスルホン酸塩、リグニンスルホン酸塩、ポリオキシエチレングリコールエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル、ポリオキシエチレンソルビタンモノアルキレート等があげられる。補助剤としては、例えばカルボキシメチルセルロース、ポリエチレングリコール、アラビアゴム等があげられる。使用に際しては適当な濃度に希釈して散布するかまたは直接施用する。

【0458】本発明の除草剤は茎葉散布、土壌施用または水面施用等により使用することができる。有効成分の配合割合については必要に応じて適宜選ばれるが、粉剤または粒剤とする場合は0.01~10% (重量)、好ましくは0.05~5% (重量)の範囲から適宜選ぶのがよい。乳剤及び水和剤とする場合は1~50% (重量)、好ましくは5~30% (重量)の範囲から適宜選ぶのがよい。また、フロアブル剤とする場合は1~40% (重量)、好ましくは5~30% (重量)の範囲から適宜選ぶのがよい。

【0459】本発明の除草剤の施用量は使用される化合物の種類、対象雑草、発生傾向、環境条件ならびに使用する剤型等によってかわるが、粉剤及び粒剤のようにそのまま使用する場合は、有効成分として1ヘクタール当たり1g~50kg、好ましくは10g~10kgの範囲から適宜選ぶのがよい。また、乳剤、水和剤及びフロアブル剤とする場合のように液状で使用する場合は、0.1~50,000ppm、好ましくは10~10,000ppmの範囲から適宜選ぶのがよい。

【0460】また、本発明の化合物は必要に応じて殺虫剤、殺菌剤、他の除草剤、植物生長調節剤、肥料等と混用してもよい。

【0461】次に代表的な製剤例をあげて製剤方法を具体的に説明する。化合物、添加剤の種類及び配合比率は、これのみに限定されことなく広い範囲で変更可能である。以下の説明において「部」は重量部を意味する。

【0462】(製剤例1) 水和剤

化合物(3-0006)の10部にポリオキシエチレンオクチルフェニルエーテルの0.5部、β-ナフタレンスルホン酸ホルマリン縮合物ナトリウム塩の0.5部、珪藻土の20部、クレーの69部を混合粉碎し、水和剤を得た。

【0463】(製剤例2) フロアブル剤

粗粉碎した化合物(3-0006)20部を水69部に

(182)

特開2002-308857

361

分散させ、ポリオキシエチレンスチレン化フェニルエーテル硫酸塩4部、エチレングリコール7部を加えるとともにシリコーンAF-118N（旭化成工業株式会社製）を製剤に対し200ppm加え、高速攪拌機にて30分間混合した後、湿式粉砕機にて粉砕しフロアブル剤を得た。

【0464】（製剤例3） 乳剤

化合物（3-0006）の30部にキシレンとイソホロンの等量混合物60部、界面活性剤ポリオキシエチレンソルビタンアルキレート、ポリオキシエチレンアルキルアリールポリマー及びアルキルアリールスルホネートの混合物の10部を加え、これらをよくかきまぜることによって乳剤を得た。

【0465】（製剤例4） 粒剤

化合物（3-0006）の10部、タルクとベントナイトを1：3の割合で混合した増量剤の80部、ホワイトカーボンの5部、界面活性剤ポリオキシエチレンソルビタンアルキレート、ポリオキシエチレンアルキルアリールポリマー及びアルキルアリールスルホネートの混合物の5部に水10部を加え、よく練ってペースト状としたものを直径0.7mmのふるい穴から押し出して乾燥した後に0.5～1mmの長さに切断し、粒剤を得た。

362

【0466】次に試験例をあげて本発明化合物の奏する効果を説明する。

【0467】（試験例1） 水田土壌処理による除草効果試験

100cm²プラスチックポットに水田土壌を充填し、代掻後、タイヌビエ、コナギの種子を播種し、水深3cmに湛水した。翌日、製剤例1に準じて調製した水和剤を水で希釈し、水面滴下した。施用量は、有効成分を、1ヘクタール当り1000gとした。その後、温室内で育成し、処理後21日目に表145の基準に従って除草効果を調査した。結果を表146～表148に示す。

【0468】

【表145】

| 指数 | 指数 除草効果(生育抑制程度)及び被害 |
|----|---------------------|
| 5 | 90%以上の播種の除草効果、被害 |
| 4 | 70%以上90%未満の除草効果、被害 |
| 3 | 50%以上70%未満の除草効果、被害 |
| 2 | 30%以上50%未満の除草効果、被害 |
| 1 | 10%以上30%未満の除草効果、被害 |
| 0 | 0%以上10%未満の除草効果、被害 |

【0469】

【表146】

(183)

特開2002-308857

363

364

| 化合物番号 | 薬量(g a.i./ha) | サイズ | コナキ |
|--------|---------------|-----|-----|
| 1-0001 | 1000 | 5 | 5 |
| 1-0002 | 1000 | 5 | 5 |
| 1-0003 | 1000 | 5 | 5 |
| 1-0004 | 1000 | 5 | 5 |
| 1-0005 | 1000 | 5 | 5 |
| 2-0001 | 1000 | 5 | 5 |
| 2-0003 | 1000 | 5 | 5 |
| 2-0004 | 1000 | 5 | 5 |
| 2-0005 | 1000 | 5 | 5 |
| 2-0006 | 1000 | 5 | 5 |
| 2-0008 | 1000 | 5 | 5 |
| 2-0011 | 1000 | 5 | 5 |
| 2-0012 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0002 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0004 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0009 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0013 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0014 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0015 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0018 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0034 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0035 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0037 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0038 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0039 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0040 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0041 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0044 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0047 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0049 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0051 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0054 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0055 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0060 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0061 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0070 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0072 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0073 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0074 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0081 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0082 | 1000 | 5 | 5 |

[0470]

[表147]

(184)

特開2002-308857

365

| 化合物番号 | 薬量(g a.i./ha) | サイズ | コキ |
|--------|---------------|-----|----|
| 3-0083 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0084 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0085 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0086 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0087 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0088 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0089 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0090 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0091 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0100 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0101 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0102 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0103 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0114 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0115 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0117 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0118 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0119 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0120 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0121 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0124 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0125 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0126 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0127 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0128 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0129 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0130 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0131 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0134 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0135 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0137 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0139 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0144 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0153 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0155 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0160 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0173 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0174 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0176 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0177 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0178 | 1000 | 5 | 5 |

10

20

30

365

| 化合物番号 | 薬量(g a.i./ha) | サイズ | コキ |
|---------|---------------|-----|----|
| 3-0180 | 1000 | 5 | 5 |
| 4-0001 | 1000 | 5 | 5 |
| 4-0002 | 1000 | 5 | 5 |
| 4-0005 | 1000 | 5 | 5 |
| 4-0007 | 1000 | 5 | 5 |
| 4-0008 | 1000 | 5 | 5 |
| 5-0001 | 1000 | 5 | 5 |
| 5-0002 | 1000 | 5 | 5 |
| 5-0003 | 1000 | 5 | 5 |
| 5-0005 | 1000 | 5 | 5 |
| 5-0006 | 1000 | 5 | 5 |
| 5-0007 | 1000 | 5 | 5 |
| 6-0003 | 1000 | 5 | 5 |
| 6-0004 | 1000 | 5 | 5 |
| 7-0004 | 1000 | 5 | 5 |
| 7-0006 | 1000 | 5 | 5 |
| 7-0008 | 1000 | 5 | 5 |
| 7-0009 | 1000 | 5 | 5 |
| 8-0001 | 1000 | 5 | 5 |
| 8-0012 | 1000 | 5 | 5 |
| 9-0001 | 1000 | 5 | 5 |
| 9-0003 | 1000 | 5 | 5 |
| 9-0005 | 1000 | 5 | 5 |
| 9-0006 | 1000 | 5 | 5 |
| 9-0008 | 1000 | 5 | 5 |
| 10-0002 | 1000 | 5 | 4 |
| 10-0003 | 1000 | 5 | 5 |
| 10-0004 | 1000 | 5 | 5 |
| 10-0005 | 1000 | 5 | 5 |
| 10-0006 | 1000 | 5 | 5 |
| 10-0008 | 1000 | 5 | 5 |
| 10-0009 | 1000 | 5 | 5 |
| 10-0011 | 1000 | 5 | 5 |
| 10-0012 | 1000 | 5 | 5 |
| 10-0013 | 1000 | 5 | 5 |
| 10-0014 | 1000 | 5 | 5 |
| 10-0015 | 1000 | 5 | 5 |
| 10-0016 | 1000 | 5 | 5 |
| 10-0017 | 1000 | 5 | 5 |
| 10-0018 | 1000 | 5 | 5 |

【0471】

【表148】

【0472】(試験例2) 畑地土壌処理による除草効果試験

80cm³プラスチックポットに畑地土壌を充填し、イヌビエ、エノコログサの種子を播種して覆土した。調剤例1に準じて調製した水和剤を水で希釈し、1ヘクタール当り有効成分が1000gになる様に、1ヘクタール当り1000lを小型噴霧器で土壌表面に均一に散布した。その後、温室内で育成し、処理21日目に表145の基準に従って、除草効果を調査した。結果を表149～表152に示す。

【0473】

【表149】

(185)

特開2002-308857

367

368

| 化合物番号 | 薬量(g a.i./ha) | イソエ | エ/コブグサ |
|--------|---------------|-----|--------|
| 1-0001 | 1000 | 5 | 5 |
| 1-0002 | 1000 | 5 | 5 |
| 1-0003 | 1000 | 5 | 5 |
| 1-0004 | 1000 | 5 | 5 |
| 1-0005 | 1000 | 5 | 5 |
| 1-0006 | 1000 | 5 | 4 |
| 2-0001 | 1000 | 5 | 5 |
| 2-0003 | 1000 | 5 | 5 |
| 2-0004 | 1000 | 5 | 5 |
| 2-0005 | 1000 | 5 | 5 |
| 2-0006 | 1000 | 5 | 4 |
| 2-0007 | 1000 | 4 | 4 |
| 2-0008 | 1000 | 5 | 5 |
| 2-0011 | 1000 | 5 | 4 |
| 2-0012 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0002 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0004 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0006 | 1000 | 4 | 4 |
| 3-0008 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0009 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0012 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0013 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0015 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0016 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0017 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0018 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0019 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0020 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0034 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0036 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0037 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0038 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0039 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0040 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0041 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0043 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0044 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0047 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0048 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0049 | 1000 | 5 | 5 |

10

20

30

| 化合物番号 | 薬量(g a.i./ha) | イソエ | エ/コブグサ |
|--------|---------------|-----|--------|
| 3-0050 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0053 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0054 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0056 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0059 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0060 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0063 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0070 | 1000 | 4 | 4 |
| 3-0072 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0073 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0074 | 1000 | 6 | 5 |
| 3-0081 | 1000 | 6 | 5 |
| 3-0082 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0083 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0084 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0085 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0086 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0087 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0088 | 1000 | 6 | 4 |
| 3-0091 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0114 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0115 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0117 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0118 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0119 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0120 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0121 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0124 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0125 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0126 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0127 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0128 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0129 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0130 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0131 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0134 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0135 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0136 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0137 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0138 | 1000 | 4 | 5 |

[0474]
[表150]

[0475]
[表151]

| 化合物番号 | 薬量 (g a.i./ha) | イヌビエ | エノコログサ |
|--------|----------------|------|--------|
| 3-0139 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0139 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0142 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0143 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0144 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0153 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0156 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0173 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0174 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0180 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0180 | 1000 | 5 | 5 |
| 4-0001 | 1000 | 5 | 5 |
| 4-0001 | 1000 | 4 | 3 |
| 4-0002 | 1000 | 5 | 5 |
| 4-0005 | 1000 | 5 | 5 |
| 4-0006 | 1000 | 5 | 5 |
| 4-0007 | 1000 | 5 | 5 |
| 4-0008 | 1000 | 5 | 5 |
| 5-0001 | 1000 | 5 | 5 |
| 5-0002 | 1000 | 5 | 5 |
| 5-0003 | 1000 | 5 | 5 |
| 5-0005 | 1000 | 5 | 4 |
| 5-0006 | 1000 | 5 | 5 |
| 5-0007 | 1000 | 5 | 5 |
| 6-0001 | 1000 | 5 | 5 |
| 6-0003 | 1000 | 5 | 5 |
| 6-0004 | 1000 | 5 | 5 |
| 7-0002 | 1000 | 5 | 5 |
| 7-0004 | 1000 | 5 | 4 |
| 7-0006 | 1000 | 5 | 5 |
| 7-0007 | 1000 | 5 | 4 |
| 7-0008 | 1000 | 5 | 5 |
| 7-0009 | 1000 | 5 | 5 |
| 8-0001 | 1000 | 5 | 5 |
| 8-0004 | 1000 | 5 | 5 |
| 8-0005 | 1000 | 5 | 4 |
| 8-0007 | 1000 | 5 | 5 |
| 9-0001 | 1000 | 5 | 5 |
| 9-0005 | 1000 | 5 | 4 |
| 9-0006 | 1000 | 5 | 4 |
| 9-0007 | 1000 | 4 | 4 |

【0476】

【表152】

| 化合物番号 | 薬量 (g a.i./ha) | イヌビエ | エノコログサ |
|---------|----------------|------|--------|
| 9-0008 | 1000 | 5 | 5 |
| 10-0003 | 1000 | 5 | 5 |
| 10-0004 | 1000 | 5 | 5 |
| 10-0005 | 1000 | 5 | 5 |
| 10-0006 | 1000 | 5 | 4 |
| 10-0009 | 1000 | 5 | 5 |
| 10-0012 | 1000 | 5 | 4 |
| 10-0013 | 1000 | 5 | 5 |
| 10-0014 | 1000 | 5 | 5 |
| 10-0015 | 1000 | 5 | 5 |
| 10-0016 | 1000 | 5 | 4 |
| 10-0017 | 1000 | 5 | 5 |
| 10-0018 | 1000 | 5 | 5 |

10

【0477】(試験例3) 畑地茎葉処理による除草効果試験

80cm²プラスチックポットに砂を充填し、イヌビエ、エノコログサの種子を播種し、温室内で2週間育成後、試験例1に準じて調製した水和剤を水に希釈し、1ヘクタール当り有効成分が1000gになる様に、1ヘクタール当り1000lを小型噴霧器で植物体の上方から全体に茎葉散布処理した。その後、温室内で育成し、処理14日目に表145の基準に従って、除草効果を調査した。結果を表153～表154に示す。

20

【0478】

【表153】

30

(187)

特開2002-308857

371

372

| 化合物番号 | 薬量(g a.i./ha) | イネ | エノコグサ |
|--------|---------------|----|-------|
| 1-0001 | 1000 | 5 | 4 |
| 1-0004 | 1000 | 5 | 4 |
| 2-0001 | 1000 | 5 | 4 |
| 2-0003 | 1000 | 5 | 4 |
| 2-0004 | 1000 | 5 | 4 |
| 2-0008 | 1000 | 5 | 5 |
| 2-0011 | 1000 | 5 | 4 |
| 3-0009 | 1000 | 4 | 4 |
| 3-0010 | 1000 | 5 | 4 |
| 3-0011 | 1000 | 5 | 4 |
| 3-0013 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0015 | 1000 | 5 | 4 |
| 3-0035 | 1000 | 4 | 4 |
| 3-0036 | 1000 | 4 | 4 |
| 3-0037 | 1000 | 5 | 4 |
| 3-0038 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0039 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0044 | 1000 | 5 | 4 |
| 3-0049 | 1000 | 4 | 4 |
| 3-0073 | 1000 | 5 | 4 |
| 3-0074 | 1000 | 5 | 4 |
| 3-0076 | 1000 | 5 | 4 |
| 3-0077 | 1000 | 5 | 4 |
| 3-0081 | 1000 | 4 | 4 |
| 3-0082 | 1000 | 4 | 4 |
| 3-0083 | 1000 | 4 | 4 |
| 3-0084 | 1000 | 4 | 4 |
| 3-0085 | 1000 | 4 | 4 |
| 3-0086 | 1000 | 4 | 4 |
| 3-0092 | 1000 | 4 | 4 |
| 3-0104 | 1000 | 5 | 4 |
| 3-0105 | 1000 | 5 | 4 |
| 3-0106 | 1000 | 5 | 4 |
| 3-0107 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0115 | 1000 | 5 | 4 |
| 3-0118 | 1000 | 5 | 4 |
| 3-0119 | 1000 | 5 | 4 |
| 3-0120 | 1000 | 5 | 5 |
| 3-0144 | 1000 | 5 | 5 |
| 4-0002 | 1000 | 5 | 4 |
| 4-0005 | 1000 | 5 | 4 |

【0479】

* * 【表154】

| 化合物番号 | 薬量(g a.i./ha) | イネ | エノコグサ |
|--------|---------------|----|-------|
| 5-0001 | 1000 | 5 | 4 |
| 5-0002 | 1000 | 5 | 5 |
| 5-0003 | 1000 | 5 | 4 |
| 5-0007 | 1000 | 5 | 5 |
| 6-0004 | 1000 | 5 | 4 |
| 7-0008 | 1000 | 5 | 5 |
| 7-0009 | 1000 | 4 | 4 |
| 8-0001 | 1000 | 5 | 4 |
| 9-0001 | 1000 | 4 | 4 |
| 9-0005 | 1000 | 4 | 4 |
| 9-0008 | 1000 | 4 | 4 |

【0480】

【発明の効果】一般式【I】で表される本発明の化合物は、畑地において問題となる種々の雑草、例えばオオイ

ヌタデ、アオビユ、シロザ、ハコベ、イチビ、アメリカキンゴシカ、アメリカツノクサネム、アサガオ、オナモミ等の広葉雑草をはじめ、ハマスゲ、キハマスゲ、ヒメ

(188)

特開2002-308857

373

クダ、カヤツリグサ、コゴメガヤツリ等の多年生および1年生カヤツリグサ科雑草、ヒエ、メヒシバ、エノコログサ、スズメノカタビラ、ジョンソングラス、ノスズメノテッポウ、野生エンバク等のイネ科雑草の発芽前から生育期の広い範囲にわたって優れた除草効果を発揮する。また、水田に発生するタイヌビエ、タマガヤツリ、コナギ等の一年生雑草及びウリカワ、オモダカ、ミズガ*

374

*ヤツリ、クログワイ、ホタルイ、ヘラオモダカ等の多年生雑草を防除することもできる。

【0481】一方、本発明の除草剤は作物に対する安全性も高く、中でもイネ、コムギ、オオムギ、トウモロコシ、グレインソルガム、ダイズ、ワタ、テンサイ等に対して高い安全性を示す。

フロントページの続き

| (51)Int. Cl. | 識別記号 | F i | ターム (参考) |
|----------------|---------------------|--------------------------------|--------------------------------|
| A 0 1 N 47/15 | | C 0 7 D 261/08 | |
| 47/38 | | 413/12 | |
| C 0 7 D 261/08 | | 417/12 | |
| 413/12 | | A 0 1 N 43/82 | 1 0 4 |
| 417/12 | | | 1 0 2 |
| (72)発明者 宮崎 雅弘 | 静岡県磐田郡堀田町堀新田408番地の1 | (72)発明者 高橋 智 | 静岡県静岡市吉野町5番地の18 |
| 株式会社ケイ・アイ研究所内 | | Fターム(参考) | 4C056 AA01 AB01 AC01 AD01 AE02 |
| (72)発明者 角 康一郎 | 静岡県磐田郡堀田町堀池276番地の1 | AF05 FA03 FA07 | |
| 藤波 周 | 静岡県小笠原郡菊川町加茂1809番地 | 4C063 AA01 BB08 CC51 CC76 DD04 | |
| (72)発明者 上野 良平 | 静岡県小笠原郡菊川町加茂1809番地 | DD12 DD29 DD31 DD51 EE03 | |
| | | 4H011 AB01 AB02 BA01 BB10 BB13 | |
| | | BB14 BC01 BC03 BC07 BC16 | |
| | | BC19 BC20 DA02 DA15 DA16 | |
| | | DC01 DC05 DC06 DC08 DD01 | |
| | | DD03 DH03 | |

**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning
Operations and is not part of the Official Record**

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

- ☐ **BLACK BORDERS**
- ☐ **IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES**
- ☒ **FADED TEXT OR DRAWING**
- ☐ **BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING**
- ☐ **SKEWED/SLANTED IMAGES**
- ☐ **COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS**
- ☐ **GRAY SCALE DOCUMENTS**
- ☐ **LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT**
- ☐ **REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY**
- ☐ **OTHER:** _____

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.